PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE

INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) (51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 405/04, A01N 43/68, C07D 251/18

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/00254

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

3. Januar 1997 (03.01.97)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/02479

A1

(22) Internationales Anmeldedatum:

7. Juni 1996 (07.06.96)

(30) Prioritätsdaten:

195 22 137.0

19. Juni 1995 (19.06.95)

DE

HOECHST SCHERING AGREVO GMBH (71) Anmelder: [DE/DE]; Miraustrasse 54, D-13509 Berlin (DE).

(72) Erfinder: LORENZ, Klaus; Am Helgengraben 18, D-64331 Weiterstadt (DE). MINN, Klemens; Rossertstrasse 61, D-65795 Hattersheim (DE). WILLMS, Lothar, Königsteiner Strasse 50, D-65719 Hofheim (DE). BAUER, Klaus; Doorner Strasse 53D, D-63456 Hanau (DE). BIERINGER, Hermann; Eichenweg 26, D-65817 Eppstein (DE). ROSINGER, Christopher; Am Hochfeld 33, D-65719 Hofheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AU, AZ, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, IL, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UZ, VN, ARIPO Patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: 2-AMINO-1,3,5-TRIAZINES, PROCESS FOR THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES AND PLANT-GROWTH REGULATORS

(54) Bezeichnung: 2-AMINO-1,3,5-TRIAZINE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS HERBIZIDE UND PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN

(57) Abstract

The invention concerns compounds of formula (I) and their salts. in which formula R1 to R9, X, Y, n and m are defined as in claim 1. which are suitable as herbicides and plant-growth regulators. They can be prepared by processes as defined in claim 6 by means of intermediate products of formula (IV), some f which are novel.

(57) Zusammenfassung

Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin R1 bis R9, X, Y n und m wie in Anspruch 1 definiert sind, eignen sich als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren. Ihre Herstellung kann nach Verfahren, wie sie in Anspruch 6

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & \stackrel{X}{\stackrel{}{\stackrel{}}} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & \stackrel{N}{\stackrel{}{\stackrel{}}} N \\
R^{4}R^{5}N & \stackrel{N}{\stackrel{}{\stackrel{}}} R^{16}
\end{array}$$
(IV)

definiert sind, über zum Teil neue Zwischenprodukte der Formel (IV) erfolgen.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX -	M7
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niger
BB	Barbados	GR	Griechenland		Niederlande
BE	Belgien	HU	Ungarn	NO	Norwegen
BF	Burkina Faso	IE	Irland	NZ	Neuseeland
BG	Bulgarien	IT.	Italien	PL	Polen
BJ	Benin	JP		PT	Portugal
BR	Brasilien	-	Japan	RO	Rumānien
BY	Belanu	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CA	Kanada	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CF		KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CG	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CH	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litzuen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ.	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	π	
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau		Trinidad und Tobago
EE	Estland	MG	Madagaskar	UA	Ukraine
ES	Spanica	ML	Mali	UG	Uganda
FI	Finnland	MN	Mongolei	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	UZ	Usbekistan
GA	Gahon	MW		VN	Vietnam
		MIW	Malawi		

ې

2-Amino-1,3,5-triazine, Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren, insbesondere der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

Es ist bekannt, daß 2-Amino-4-alkylamino-6-a-halogenalkyl-1,3,5-triazine herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften besitzen (WO 90/09378 (EP-A-411153), WO 88/02368 (EP-A-283522), WO 94/24086, EP-A-509544, EP-A-492,615). Die Anwendung vieler der bekannten Derivate dieses Typs als selektive Herbizide zur Schadpflanzenbekämpfung oder als Pflanzenwachstumsregulatoren in verschiedenen Nutzpflanzenkulturen führt jedoch häufig zu unerwünschten Schädigungen der Nutzpflanzen. Überraschenderweise wurden nun neue 2-Amino-1,3,5-triazine gefunden, die vorteilhaft als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können. Beispielsweise werden beim Einsatz der erfindungsgemäßen Verbindungen die Kulturpflanzen nicht oder in geringerem Umfang geschädigt als bei den bekannten Wirkstoffen ähnlichen Typs.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen der Formel (I) und deren Salze.

worin

- R¹ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z¹-R¹⁰,
- ${\sf R}^2$ und ${\sf R}^3$ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel - ${\sf Z}^2$ - ${\sf R}^{11}$ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen carbocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern oder einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest oder
 - R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,
- R⁶ Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
 Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis
 10 C-Atomen, vorzugsweis mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen
 Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit
 jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe

- N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest,
- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 6 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R⁹ jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₆)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C_2-C_6) Alkenyloxy, (C_2-C_6) Alkinyloxy, (C_1-C_4) Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-thiocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl oder (C1-C4)Alkylthio-thiocarbonyl, wobei die Alkylreste in den letztgenannten 11 Resten unsubstituiert oder substituiert sind, oder (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Halogenalkylsulfonyl, (C_1-C_4) Alkoxysulfonyl, Amino, Mono- oder Di-[(C1-C6)alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder $Di-[(C_1-C_6)alkyl]aminocarbonyl, (C_1-C_6)Alkanoylamino, N-(C_1-C_6)Alkanoylamino, N-(C_1-C_6$ N-(C₁-C₄)alkyl-amino oder einen Rest der Formel Z⁴-R^o, wobei Z⁴ wie unten definiert und Ro einen aromatischen, gesättigten oder teilgesättigten carbocyclischen oder heterocyclischen Rest bedeutet, wobei der cyclische Rest substituiert oder unsubstituiert ist, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest beispielsweise jeweils mit 1 bis 20 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 10, oder einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit 3 bis 8 C-Atomen, insbesondere 3 bis 6 C-Atomen, oder einen heterocyclischen Rest, vorzugsweise mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wob i jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR $^{\circ}$ oder -N(O)-, wobei q=0,1 oder 2 ist und R $^{\circ}$ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -0-, -S(O)_r-, -NR $^{\circ}$ oder -N(O)-, wobei r = 0, 1 oder 2 ist und R $^{\circ}$ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder ein divalente Gruppe der Formel

 -O-, -S(O)_p-, -S(O)_p-O-, -O-S(O)_p-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -O-NR'-, -NR'-O-, -NR'-CO-, -CO-NR'- bedeutet und dabei p = 0, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
- m 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1 oder 2, und
- n 0, 1, 2, 3, 4 oder 5, vorzugsweise 0, 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 2 oder 3,

bedeuten.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise HCI, HBr, H₂SO₄ oder HNO₃, aber auch Oxalsäure oder Sulfonsäuren an eine basiche Gruppe, wie z.B. Amino oder Alkylamino, Salze bilden. Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, vorliegen können, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen bilden. Salze können ebenfalls dadurch gebildet werden, daß bei geeigneten Substituenten, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, der Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Aminen.

In Formel (I) und allen nachfolgenden Formeln können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino und Alkylthio sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste; Alkenyl bedeutet z.B. Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, But-3-in-1-yl, 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Cycloalkyl bedeutet ein carbocyclisches, gesättigtes Ringsystem mit vorzugsweise 3-8 C-Atomen, z.B. Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Halogen bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor und/oder Brom, insbesondere durch Fluor oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl), Perhaloalkyl, CF₃, CHF₂, CH₂F, CF₃CF₂, CH₂FCHCl, CCl₃, CHCl₂, CH₂Cl; Haloalkoxy ist z.B. OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ und OCH₂CH₂Cl; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

Ein Kohlenwasserstoffrest ist ein geradkettiger, verzweigter oder cyclischer und gesättigter oder ungesättigter aliphatischer oder aromatischer Kohlenwasserstoffrest, z.B. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl; Aryl bedeutet dabei ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl,

Pentalenyl, Fluorenyl und ähnliches, vorzugsweise Phenyl; vorzugsweise bedeutet ein Kohlenwasserstoffrest Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit bis zu 12 C-Atomen oder Cycloalkyl mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Ringatomen oder Phenyl; entsprechendes gilt für einen Kohlenwasserstoffrest in einem Kohlenwasserstoffoxyrest.

Ein heterocyclischer Rest oder Ring (Heterocyclyl) kann gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch sein; er enthält vorzugsweise eine oder mehrere Heteroeinheiten im Ring, d.h. Heteroatome oder Ringglieder, welche auch substituierte Heteroatome einschließen, vorzugsweise aus der Gruppe N, O, S, SO, SO₂; vorzugsweise ist er ein aliphatischer Heterocyclylrest mit 3 bis 7 Ringatomen oder ein heteroaromatischer Rest mit 5 oder 6 Ringatomen und enthält 1, 2 oder 3 Heteroeinheiten. Der heterocyclische Rest kann z.B. ein heteroaromatischer Rest oder Ring (Heteroaryl) sein, wie z.B. ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, in dem mindestens 1 Ring ein oder mehrere Heteroatome enthält, beispielsweise Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Thienyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Furyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl und Imidazolyl, oder ist ein partiell oder vollständig hydrierter Rest wie Oxiranyl, Pyrrolidyl, Piperidyl, Piperazinyl, Dioxolanyl, Morpholinyl, Tetrahydrofuryl. Als Substituenten für einen substituierten heterocyclischen Rest kommen die weiter unten genannten Substituenten in Frage, zusätzlich auch Oxo. Die Oxogruppe kann auch an den Heteroringatomen, die in verschiedenen Oxidationsstufen existieren können, z.B. bei N und S, auftreten.

Substituierte Reste, wie substituierte Kohlenwasserstoffreste, z.B. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Aryl, Phenyl und Benzyl, oder substituiertes Heterocyclyl oder Heteroaryl, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Dialkylaminocarbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und Dialkylamino, und Alkylsulfinyl, Haloalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl,

Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch Alkyl und Haloalkyl bedeuten; im Begriff "substituierte Reste" wie substituiertes Alkyl etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Phenyl, Phenoxy etc. eingeschlossen. Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen, bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C₁-C₄)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C₁-C₄)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy und Chlor.

Mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen chemisch stabilen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Alkoxy, Acyl und Aryl N-substituiert sind; vorzugsweise Monoalkylamino, Dialkylamino, Acylamino, Arylamino, N-Alkyl-N-arylamino sowie N-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise (C₁-C₄)Alkanoyl. Entsprechenes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Halogenalkyl, (C_1-C_4) Halogenalkoxy und Nitro substituiert ist, z.B. o-, mund p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluorund -Trichlorphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Ein Acylrest bedeutet den Rest einer organischen Säure, z.B. den Rest einer Carbonsäure und Reste davon abgeleiteter Säuren wie der Thiocarbonsäure, gegebenenfalls N-substituierten Iminocarbonsäuren oder den Rest von Kohlensäuremonoestern, gegebenenfalls N-substituierter Carbaminsäure, Sulfonsäuren, Sulfinsäuren, Phosphonsäuren, Phosphinsäuren. Acyl bedeutet beispielsweise Formyl, Alkylcarbonyl wie [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Phenylcarbonyl, Alkyloxycarbonyl, Phenyloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Alkylsulfinyl, N-Alkyl-1-iminoalkyl und andere Reste von organischen Säuren. Dabei können die Reste jeweils im Alkyl- oder Phenylteil noch weiter substituiert sein, beispielsweise im Alkylteil durch ein oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Phenyl und Phenoxy; Beispiele für Substituenten im Phenylteil sind die bereits weiter oben allgemein für substituiertes Phenyl erwähnten Substituenten.

Gegenstand der Erfindung sind auch alle Stereoisomeren, die von Formel (I) umfaßt sind, und deren Gemische. Solche Verbindungen der Formel (I) enthalten ein oder mehrere asymmetrische C-Atome oder auch Doppelbindungen, die in den allgemeinen Formeln (I) nicht gesondert angegeben sind. Die durch ihre spezifische Raumform definierten möglichen Stereoisomeren, wie Enantiomere, Diastereomere, Z- und E-Isomere sind alle von der Formel (I) umfaßt und können nach üblichen Methoden aus Gemischen der Stereoisomeren erhalten oder auch durch stereoselektive Reaktionen in Kombination mit dem Einsatz von stereochemisch reinen Ausgangsstoffen hergestellt werden.

Vor allem aus den Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der genannten Formel (I) oder deren Salze von besonderem Interesse, worin

R¹ H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder -Z¹-R¹⁰,

 R^2 und R^3 jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO $_2$, CN, SCN oder einen Rest der Formel - Z^2 - $R^{1\,1}$ oder R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3

 (C_3-C_8) Cycloalkyl, (C_3-C_8) Cycloalkenyl oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino R⁴ und R⁵ oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C2-C4)Alkenyloxy, (C2-C4)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)Alkoxy]$ -carbonyl, $[(C_1-C_4)Alkyl]$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)alkyl]$ -aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkylsulfinyl$, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $(C_1-C_4)Alkyl$ und $(C_1-C_4)Haloalkyl$ substituiert ist,

oder einen Acylrest oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R6 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen im Alkylrest, inen acyclischen oder cyclischen
Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder

Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)$ Alkoxy]-carbonyl, $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch (C_1-C_4) Alkylund (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert ist, oder einen Acylrest,

- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder
 R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl, wobei die letztgenannten fünf Reste unsubstituiert oder durch Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substituiert sind, oder (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkanoylamino oder einen Rest der Formel Z⁴-R⁰, worin Z⁴ wie unten definiert ist und R⁰ (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Cycloalkenyl oder Phenyl bedeutet, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit

zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Rest aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 1 bis 6 C-Atomen, einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 C-Atomen oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $\{(C_1-C_4)Alkoxy\}$ -carbonyl, $\{(C_1-C_4)Alkyl\}$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist, vorzugsweise R¹⁰, R¹¹, R¹² Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C2-C6)Alkinyl, (C3-C9)Cycloalkyl, (C3-C9)Cycloalkenyl, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 7 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, Amino, Mono- und Di $[(C_1-C_4)alkyl]$ amino, $(C_1-C_4)Alkanoylamino$, Benzoylamino, Nitro, Cyano, [(C1-C4)Alkyl]carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- (C_1-C_4) alkyl)aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl und, im Fall cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist,
- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR * oder -N(O)-, wobei q=0,1 oder 2 ist und R * Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -0-, -S(O)_r-, -NR ** oder -N(O)-, wobei r = 0, 1 oder 2 ist und R ** Wasserstoff oder Alkyl mit 1

bis 4 C-Atomen ist, oder ein Grupp der Formel - CH_2 -, - $C(CH_3)H$ - oder - $C(CH_3)_2$ -,

Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel

-O-, -S-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R' H oder (C_1 - C_4)Alkyl ist, vorzugsweise Z¹, Z², Z³, Z⁴ eine direkte Bindung oder Sauerstoff

bedeuten.

Von besonderem Interesse sind weiterhin erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin

R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C1-C4)Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino, Halo-(C_1-C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1-C_4)alkyl,$ $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo- (C_1-C_4) alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, $\label{eq:Halo-(C2-C6)Alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl, Halo-(C3-C6)alkinyl, Halo-(C3-C6)alkiny$ (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl, amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C1-C4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl (C_1-C_4)$ alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C1-C4)Alkyl,

 (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

- R² und R³ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR²R³ einen gesättigten oder teilweise ungesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe O, N und S, wobei jeder der letztgenannten 2 cyclischen Reste unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy,

Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, (C_3-C_9) Heterocyclyl- (C_1-C_4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C_1-C_4) Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalk xy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9

Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 ${\sf R}^7$ und ${\sf R}^8$ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $({\sf C}_1\text{-}{\sf C}_4)$ Alkyl und Oxo substituiert ist,

wenn n = 1 ist, und die Reste R⁹, jeweils unabhängig voneinander, wenn R⁹. n größer als 1 ist, Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C1-C4)Alkyl, Cyano-(C1-C4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino$, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylthio, Halo-(C_1-C_4)alkylthio,$ (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C1-C4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C1-C4)Alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, Formyl, $(C_1-C_4)Aikyl$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Aikoxy$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Aikoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit

zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-bedeuten.

Von besonderem Interesse sind auch erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin

- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu insgesamt drei, Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkyl, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkoxy, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkylamino, Di- $[(C_1\text{-}C_4)$ alkyl]-amino, Halo- $(C_1\text{-}C_4)$ alkyl, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkoxy- $(C_1\text{-}C_4)$ alkyl, $(C_2\text{-}C_6)$ Alkenyl, $(C_2\text{-}C_6)$ Alkinyl, Phenyl oder Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu insgesamt drei, Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkyl, $(C_1\text{-}C_4)$ Alkoxy und $(C_1\text{-}C_4)$ Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen gesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern, der unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe $(C_1\text{-}C_4)$ Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,
- $\rm R^4$ und $\rm R^5$ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C $_1$ -C $_4$)Alkyl, (C $_1$ -C $_4$)Alkoxy-(C $_1$ -C $_4$)alkyl, (C $_2$ -C $_6$)Alkenyl, (C $_2$ -C $_6$)Alkinyl, (C $_1$ -C $_4$)Alkylamino-(C $_1$ -C $_4$)alkyl, Di-[(C $_1$ -C $_4$)alkyl)-amino-(C $_1$ -C $_4$)alkyl oder

Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder Phenoxy-carbonyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil bis zu dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Dialkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylamino-carbonyl oder einen der letztgenannten fünf Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Di-[(C_1-C_4) alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl)-amino, Perhalo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl)-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl,

Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxycarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylcarbonyl, (C_1-C_4) Alkyloxycarbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 13 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten 3 bis 6 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N und 0 aufweist, oder

zwei benachbarte Reste R^9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste (C_1-C_4) Alkyl substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Methyl ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Methyl ist, bedeuten.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze sind solche, worin

- R¹ Wasserstoff, Halogen oder (C₁-C₄)Alkyl,
- ${
 m R}^2$ und ${
 m R}^3$ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, (C $_1$ -C $_4$)Alkyl oder Phenyl oder
 - ${\rm R^2}$ und ${\rm R^3}$ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe ${\rm CR^2R^3}$ gesättigtes ${\rm (C_4-C_6)Cycloalkyl},$
- R^4 und R^5 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl oder (C_1-C_4) Alkyl oder R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen

heterocyclischen Rest mit 4 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

R⁶ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl oder (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl oder

R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen,

 R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, $(C_1-C_4)Alkyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

m 1 oder 2,

n 2 oder 3,

X eine Gruppe der Formel -O- oder -NH- oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,

Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NHbedeuten.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel (II),

$$R^{1} - C \frac{X}{R^{15}} (CR^{2}R^{3})_{m}$$
 (11)

worin R¹⁵ eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carbonsäureester, Carbonsäureorthoester, Carbonsäurechlorid, Carbonsäureamid, Carbonsäureanhydrid und Trichlormethyl bedeutet, mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

b) eine Verbindung der Formel (IV),

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & \stackrel{X}{\subset} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N & N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^{4}R^{5}N & N & R^{16}
\end{array}$$

worin R^{16} einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, z.B. Chlor, Trichlormethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl und unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) alkylsulfonyl oder (C_1-C_4) Alkylphenylsulfonyl, bedeutet, mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt, oder

c) unter Reaktion (nucleophiler Substitution) einer austauschfähigen Gruppe am Triazin der Verbindung der genannten Formel (IV) oder der Formel (X),

$$R^{1} - C \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m}$$

$$R^{16} \longrightarrow N \qquad (X)$$

worin jeder der Reste R^{16} unabhängig voneinander einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, z.B. Chlor, Trichlormethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl und unsubstituiertes oder

d)

substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) alkylsulfonyl, bedeutet, diese Verbindung mit einem geeigneten Aziridin der Formel (XI),

worin \mathbb{R}^7 und \mathbb{R}^8 wie in Formel (I) definiert sind, und nachfolgend mit einem geeigneten Nucleophil der Formel (XII)

$$H-Y \longrightarrow (X | I)$$

unter Ringöffnung des Azirididinrings und, falls ein Triazin der Formel (X) eingesetzt wurde, durch Reaktion der noch vorhandenen austauschfähigen Gruppe am Triazingrundgerüst mit einer Verbindung der Formel NHR⁴R⁵ (Ammoniak oder Amin) umsetzt oder eine Verbindung der Formel (XIII)

durch Epoxidierung oder Cyclopropanierung in entsprechende Verbindungen der Formel (I) umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (X), (XI), (XII) und (XIII) die Reste R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 sowie X, Y, m und n wie in Formel (I) definiert sind, mit der Maßgabe, daß in Variante d) m=1 ist.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel (II) und (III) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Acetonitril, Dimethylformamid (DMF), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C; falls Säureadditionssalze der Formel (III) verwendet werden, setzt man diese in der Regel mit Hilfe einer Base in situ frei. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei beispielsweise im Bereich von 0,1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (III) eingesetzt. Die Verbindung der Formel (II) kann im Verhältnis zur Verbindung der Formel (III) beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquvälenten Überschuß eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren in der Literatur bekannt (vergleiche: Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, S.290).

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel (IV) und (V) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des jeweiligen Lösungsmittels oder Lösungsmittelgemisches, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C, wobei die Verbindung (V), falls als Säureadditionssalz eingesetzt, gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt wird. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in der Regel im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (IV) eingesetzt, die Verbindung der Formel (IV) kann beispielsweise äquimolar zur Verbindung der Formel (V) oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die

entsprechenden Verfahren aus der Literatur bekannt (vgl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, S. 482).

Die Edukte der Formeln (II), (III), (IV) und (V) sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach oder analog literaturbekannten Verfahren hergestellt werden. Die Verbindungen können beispielsweise auch nach einem der nachfolgend beschriebenen Verfahren hergestellt werden.

Die Verbindungen der Formel (III) können beispielsweise durch Reaktion der Amine der Formel (V) oder deren Salze mit Cyanoguanidin in einem inerten Lösungsmittel wie beispielsweise Chlorbenzol oder Diethylenglykol oder Tetrahydrofuran oder gegebenenfalls Wasser analog H.M. Eisa, A.S. Tantawy, M.M. El-Kerdawy, Pharmazie 46 (1991), 182-184 hergestellt werden. Gegebenenfalls kann der Zusatz von anorganischen Salze wie Eisen(III)chlorid die Reaktion beschleunigen oder eine Erniedrigung der Reaktionstemperatur bewirken (Sanwa Chem KK, JP 62215556).

Die Amine der Formel (V) oder Salze hiervon können beispielsweise durch Reduktion der entsprechenden Oxime mit beispielsweise LiAIH₄ (Bristol Labor. Inc. US 2703324) oder Hydrierung mit Wasserstoff und Raney Nickel (Suter, Zuter, Justus Liebigs Ann. Chem. 576 (1952), S. 215 ff, oder auch durch reduktive Aminierung aus den entsprechenden Acetonderivaten (vergl. A. Waefelaer, et. al., Bull. Soc. Chim. Belg. 85 (1976), 421-425) hergestellt werden.

Die Verbindung der Formel (IV), oder eine direkte Vorstufe davon, läßt sich beispielweise wie folgt herstellen:

1. Durch Reaktion einer Verbindung der Formel (II) mit inem Amidino-thioharnstoff-Derivat der Formel (VI),

worin R^{17} (C_1 - C_4)-Alkyl oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkyl bedeutet und R^4 und R^5 wie in Formel (I) definiert sind, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, in denen $R^{16} = -SR^{17}$ bedeutet.

 Durch Umsetzung eines cyclischen Amidins der Formel (VII) oder eines Säureadditionssalzes davon,

$$\begin{array}{c}
R^{1} \times \times \\
 \times C \longrightarrow (CR^{2}R^{3})_{m} \\
 \times NH
\end{array}$$
(VII)

worin R¹, R², R³, X und m wie in Formel (I) definiert sind, mit einem N-Cyanodithioiminocarbonat der Formel (VIII),

$$NC-N=C$$
 $S-R^{18}$
 $S-R^{18}$
(VIII)

worin R^{18} (C_1 - C_4)-Alkyl oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkyl bedeutet, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin $R^{16} = -S - R^{18}$ bedeutet.

- 3. Durch Umsetzung eines Alkali-dicyanamids mit einem cyclischen Carbonsäurederivat der genannten Formel (II) werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin $R^{16} = NH_2$ bedeutet,
- 4. Durch Umsetzung von Trichloracetonitril mit einem cyclischen Carbonsäurenitril der Formel (IX),

worin R^1 , R^2 , R^3 , X und m wie in Formel (I) definiert sind, werden zunächst Verbindungen der Formel (X), worin $R^{16} = CCl_3$ ist, erhalten,

w Iche durch nachfolgende Umsetzung mit Verbindungen der Formel HNR^4R^5 (R^4 und R^5 wie in Formel (I)), zu Verbindungen der Formel (IV), worin $R^{16} = CCl_3$ bedeutet, führen.

Gegebenenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. auch Zwischenprodukte der Formel (X),

mit 2 austauschfähigen Gruppen R^{16} hergestellt werden (vgl. Formel (IV)) und die austauschfähigen Gruppen nacheinander mit geeigneten Aminen oder Ammoniak substituiert werden, um analog allgemein bekannten Verfahrensweisen zu Verbindungen der Formel (I) zu gelangen. Gegebenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. erhaltene Zwischenprodukte der Formel (X), worin R^{16} (C_1 - C_4)-Alkylthio oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkylthio bedeutet, durch eine Chlorierung oder Oxidation in reaktionsfähigere Derivate der Formeln (X) umgewandelt werden.

Ebenso sind nach literaturbekannten Verfahren oder nach den zuvor genannten Verfahren, wobei dann offenkettige, olefinische Derivate analog zu Verbindungen der Formel (II), (VII), (IX), in denen X eine C-C-Bindung und m=1 darstellten, eingesetzt werden, Verbindungen der Formel (XIII) herstellbar.

Die Umsetzung der Carbonsäurederivate der Formel (II) mit den Amidinothioharnstoff-Derivaten der Formel (VI) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem organischen Lösungsmittel, wie z.B. Aceton, THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol, Ethanol, bei Temp raturen von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 0 °C bis 20 °C. Die Umsetzung kann aber auch in Wasser oder in wässrigen

Lösungsmitttelgemischen mit einem oder mehreren der obengenannten organischen Lösungsmitteln erfolgen. Falls (VI) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (VI) eingesetzt. Verbindungen der Formel (III) und (VI) können beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß an Verbindung der Formel (III) eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, Chem. Ber.; 1967, 100, 1874), die entsprechenden Zwischenprodukte der Formel (IV) sind neu.

Die Umsetzung der cyclischen Amidine der Formel (VII) mit den N-Cyanodithioiminocarbonaten der Formel (VIII) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Acetonitril, DMF, Dimethylacetamid (DMA), N-Methylpyrrolidon (NMP), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C. Falls (VII) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (VIII) eingesetzt, Verbindungen der Formel (VIII) und (VIII) können in der Regel äquimolar oder mit 2 Moläquvalenten Überschuß an Verbindung der Formel (II) eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714), die entsprechenden Zwischenprodukte der Formel (IV) sind neu.

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (X) mit R¹⁶ = Chlor kann durch Reaktion von Alkali-dicyanamid mit einem cyclischen Carbonsäurederivat der Formel (II), wobei dann R¹⁵ bevorzugt die funktionelle Gruppe Carbonsäurechlorid oder Carbonsäureamid bedeutet, erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt, des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, wobei die entstehend n Intermediate in situ mit einem geeigneten Chlorierungsreagenz wie beispielsweise Phosphoroxychlorid chloriert werden können. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren, wie HCl, oder auch Lewis-Säuren, wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vergl. US-A-5095113, DuPont).

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (X) mit R¹⁶ = Trihalogenmethyl kann durch Reaktion der entsprechenden Trihalogenessigsäurenitrile mit einem cyclischen Carbonsäurenitril der Formel (IX) erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -40 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei -10 °C bis 30 °C. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren wie HCI oder auch Lewis-Säuren wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vgl. EP-A-130939, Ciba Geigy).

Zwischenprodukte der Formel (IV) oder (X), worin $R^{16}=(C_1\text{-}C_4)$ Alkylmercapto oder unsubstituiertes Phenyl- $(C_1\text{-}C_4)$ -alkylmercapto ist, können in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z .B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen oder anderen bei Temperaturen zwischen -40 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, mit einem geeigneten Chlorierungsreag nz wie z.B. elementarem Chlor oder Phosporoxychlorid zu reaktionsfähigeren Chlortriazinen der Formel (IV) oder (X),

worin $R^{16} = Cl$ ist, überführt werden (vgl. J.K. Chakrabarti, D.E. Tupper; Tetrahedron 1975, 31(16), 1879-1882).

Zwischenprodukte der Formel (IV) oder (X), wobei $R^{16}=(C_1-C_4)$ Alkylmercapto oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) -alkylmercapto oder (C_1-C_4) Alkyl-phenylthio ist, können in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. chlorierten Kohlenwasserstoffen, Essigsäure, Wasser, Alkoholen, Aceton oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen 0 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise von 20 °C bis 80 °C, mit einem geeigneten Oxidationssreagenz wie z.B. m-Chlorperbenzoesäure, Wasserstoffperoxid, Kaliumperoxomonosulfat oxidiert werden (vergl.: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714).

Verbindungen analog der Formel (IV) erhält man auch durch selektive nucleophile Substitution einer austauschfähigen Gruppe bei Verbindungen analog der Formel (X), wobei R¹⁶ beispielsweise für Halogen, Perhalomethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl oder andere literaturbekannte Abgangsgruppen steht, in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 10 °C bis 25 °C, gegebenfalls unter basischen Bedingungen. Als Basen eignen sich dabei Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (X) eingesetzt; das Nucleophil wird in der Regel äquimolar bis zu 2 Moläquivalenten im Überschuß eingesetzt und kann gegebenfalls auch selbst als Base gebraucht werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: V.I. Kaelarev, Dibi Ammar, A.F. Lunin; Ximinya Geterosikl. Soedin., 1985, N11, 1557 - 1563).

Analog kann man durch Substitution einer Abgangsguppe von Triazinen der Formel (IV) oder (X) mit Aziridinen der Formel (XI) gegebenfalls unter Basenzusatz in einem geeigneten inerten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, Aziridinyltriazine herstellen. Als Basen eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (IV) oder (X) eingesetzt; das Aziridin kann mit bis zu 3 Moläquvalenten überschüssig eingesetzt und gegebenfalls auch selbst als Base gebraucht werden. Nachfolged kann der Aziridin-Ring geöffnet werden. Hierzu werden beispielsweise in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril die Zwischenverbindungen mit Nucleophilen der Formel (XII) bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, zur Reaktion gebracht. Das Verfahren der Ringöffnung ist im Prinzip bekannt (vergl.: M.D. Nair, J.D. Nagarajan, Indian J. Chem.; 1985, 24B, 940; oder JP 03005466; Chem. Abstracts 115:4914); neu ist die Ringöffnung bei Triazinylderivaten.

Zur Herstellung der Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) kommen folgende Säuren in Frage: Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, weiterhin Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, mono- oder bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren wie Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Citronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure oder Milchsäure, sowie Sulfonsäuren wie p-Toluolsulfonsäure oder 1,5-Naphtalindisulfonsäure. Die Säureadditionsverbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach den üblichen Salzbildungsmethod n, z.B. durch Lösen einer V rbindung der Formel (I) in einem geeigneten organischen Lösungsmittel wie z.B. Methanol, Aceton, Methylenchlorid oder Benzin und Hinzufügen der Säure bei Temperaturen von

O bis 100 °C erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösemittel gereinigt werden.

Die Basenadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) werden vorzugsweise in inerten polaren Lösungsmitteln wie z.B. Wasser, Methanol oder Aceton bei Temperaturen von 0 bis 100 °C hergestellt. Geeignete Basen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Salze sind beispielsweise Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, Alkali- und Erdalkalihydroxide, z.B. NaOH oder KOH, Alkali- und Erdalkalihydride, z.B. NaH, Alkali- und Erdalalkoholate, z.B. Natriummethanolat, Kalium-tert.Butylat, oder Ammoniak oder Ethanolamin.

Mit den in den vorstehenden Verfahrensvarianten bezeichneten "inerten Lösungsmitteln" sind jeweils Lösungsmittel gemeint, die unter den jeweiligen Reaktionsbedingungen inert sind, jedoch nicht unter beliebigen Reaktionsbedingungen inert sein müssen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden zusammen als (erfindungsgemäße) Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden.

Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria sowie Cyperusarten aus der annu Ilen Gruppe und auf seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.

Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z.B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon und Sida auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Unkräuter wie z.B. Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus und Cyperus werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen

WO 97/00254 PCT/EP96/02479

33

Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen monound dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, die Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside,
Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden
beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents
and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction
to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden,
"Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents
and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood,
"Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964;
Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell.,
Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7,
C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutylnaphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden

Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calzium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I). In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-%

an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe einsetzbar, wie sie in z.B. aus Weed Research 26, 441-445 (1986), oder "The Pesticide Manual", 10th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1994 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als literaturbekannte Herbizide, die mit den Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (Anmerkung: Die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen, ggf. zusammen mit einer üblichen Codenummer bezeichnet):

acetochlor; acifluorfen; aclonifen; AKH 7088, d.h. [[[1-[5-[2-Chloro-4-(trifluoromethyl)-phenoxy]-2-nitrophenyl]-2-methoxyethylidene]-amino]-oxy]-essigsäure und -essigsäuremethylester; alachlor; alloxydim; ametryn; amidosulfuron; amitrol; AMS, d.h. Ammoniumsulfamat; anilofos; asulam; atrazin; azimsulfurone (DPX-A8947); aziprotryn; barban; BAS 516 H, d.h. 5-Fluor-2-phenyl-4H-3,1-benzoxazin-4-on; benazolin; benfluralin; benfuresate; bensulfuron-methyl; bensulide; bentazone; benzofenap; benzofluor; benzoyl-

prop-ethyl; benzthiazuron; bialaphos; bifenox; bromacil; bromobutide; bromofenoxim; bromoxynil; bromuron; buminafos; busoxinone; butachlor; butamifos; butenachlor; buthidazole; butralin; butylate; cafenstrole (CH-900); carbetamide; cafentrazone (ICI-A0051); CDAA, d.h. 2-Chlor-N,Ndi-2-propenylacetamid; CDEC, d.h. Diethyldithiocarbaminsäure-2-chlorallylester; chlomethoxyfen; chloramben; chlorazifop-butyl, chlormesulon (ICI-A0051); chlorbromuron; chlorbufam; chlorfenac; chlorflurecol-methyl; chloridazon; chlorimuron ethyl; chlornitrofen; chlorotaluron; chloroxuron; chlorpropham; chlorsulfuron; chlorthal-dimethyl; chlorthiamid; cinmethylin; cinosulfuron; clethodim; clodinafop und dessen Esterderivate (z.B. clodinafop-propargyl); clomazone; clomeprop; cloproxydim; clopyralid; cumyluron (JC 940); cyanazine; cycloate; cyclosulfamuron (AC 104); cycloxydim; cycluron; cyhalofop und dessen Esterderivate (z.B. Butylester, DEH-112); cyperquat; cyprazine; cyprazole; daimuron; 2,4-DB; dalapon; desmedipham; desmetryn; di-allate; dicamba; dichlobenil; dichlorprop; diclofop und dessen Ester wie diclofop-methyl; diethatyl; difenoxuron; difenzoquat; diflufenican; dimefuron; dimethachlor; dimethametryn; dimethenamid (SAN-582H); dimethazone, clomazon; dimethipin; dimetrasulfuron, dinitramine; dinoseb; dinoterb; diphenamid; dipropetryn; diquat; dithiopyr; diuron; DNOC; eglinazine-ethyl; EL 77, d.h. 5-Cyano-1-(1,1-dimethylethyl)-N-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamid; endothal; EPTC; esprocarb; ethalfluralin; ethametsulfuron-methyl; ethidimuron; ethiozin; ethofumesate; F5231, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid; ethoxyfen und dessen Ester (z.B. Ethylester, HN-252); etobenzanid (HW 52); fenoprop; fenoxan, fenoxaprop und fenoxaprop-P sowie deren Ester, z.B. fenoxaprop-P-ethyl und fenoxaprop-ethyl; fenoxydim; fenuron; flamprop-methyl; flazasulfuron; fluazifop und fluazifop-P und deren Ester, z.B. fluazifop-butyl und fluazifop-P-butyl; fluchloralin; flumetsulam; flumeturon; flumiclorac und dessen Ester (z.B. Pentylester, S-23031); flumioxazin (S-482); flumipropyn; flupoxam (KNW-739); flu rodifen; fluoroglycofen- thyl; flupropacil (UBIC-4243); fluridone; flurochloridone; flur xypyr; flurtamone; fomesafen; fosamine; furyloxyfen; glufosinate; glyphosate; halosafen; halosulfuron und dessen Ester (z.B.

Methylester, NC-319); haloxyfop und dessen Ester; haloxyfop-P (= Rhaloxyfop) und dessen Ester; hexazinone; imazamethabenz-methyl; imazapyr; imazaquin und Salze wie das Ammoniumsalz; imazethamethapyr; imazethapyr; imazosulfuron; ioxynil; isocarbamid; isopropalin; isoproturon; isoxaben; isoxapyrifop; karbutilate; lactofen; lenacil; linuron; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidid; metamitron; metazachlor; methabenzthiazuron; metham; methazole; methoxyphenone; methyldymron; metabenzuron, methobenzuron; metobromuron; metolachlor; metosulam (XRD 511); metoxuron; metribuzin; metsulfuron-methyl; MH; molinate; monalide; monocarbamide dihydrogensulfate; monolinuron; monuron; MT 128, d.h. 6-Chlor-N-(3-chlor-2propenyl)-5-methyl-N-phenyl-3-pyridazinamin; MT 5950, d.h. N-[3-Chlor-4-(1methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid; naproanilide; napropamide; naptalam; NC 310, d.h. 4-(2,4-dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxypyrazol; neburon; nicosulfuron; nipyraclophen; nitralin; nitrofen; nitrofluorfen; norflurazon; orbencarb; oryzalin; oxadiargyl (RP-020630); oxadiazon; oxyfluorfen; paraquat; pebulate; pendimethalin; perfluidone; phenisopham; phenmedipham; picloram; piperophos; piributicarb; pirifenop-butyl; pretilachlor; primisulfuron-methyl; procyazine; prodiamine; profluralin; proglinazine-ethyl; prometon; prometryn; propachlor; propanil; propaquizafop und dessen Ester; propazine; propham; propisochlor; propyzamide; prosulfalin; prosulfocarb; prosulfuron (CGA-152005); prynachlor; pyrazolinate; pyrazon; pyrazosulfuron-ethyl; pyrazoxyfen; pyridate; pyrithiobac (KIH-2031); pyroxofop und dessen Ester (z.B. Propargylester); quinclorac; quinmerac; quinofop und dessen Esterderivate, quizalofop und quizalofop-P und deren Esterderivate z.B. quizalofop-ethyl; quizalofop-P-tefuryl und -ethyl; renriduron; rimsulfuron (DPX-E 9636); S 275, d.h. 2-[4-Chlor-2-fluor-5-(2-propynyloxy)-phenyl]-4,5,6,7-tetrahydro-2H-indazol; secbumeton; sethoxydim; siduron; simazine; simetryn; SN 106279, d.h. 2-[[7-[2-Chlor-4-(trifluor-methyl)-phenoxy]-2-naphthalenyl]-oxy}-propansäure und -methylester; sulfentrazon (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; sulfometuronmethyl; sulfosate (ICI-A0224); TCA; tebutam (GCP-5544); tebuthiuron; terbacil; terbucarb; terbuchlor; terbumeton; terbuthylazine; terbutryn; TFH 450, d.h. N,N-Diethyl-3-[(2-ethyl-6-methylphenyl)-sulfonyl]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamid;

thenylchlor (NSK-850); thiazafluron; thizopyr (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); thifensulfuron-methyl; thiobencarb; tiocarbazil; tralkoxydim; tri-allate; triasulfuron; triazofenamide; tribenuron-methyl; triclopyr; tridiphane; trietazine; trifluralin; triflusulfuron und Ester (z.B. Methylester, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; vernolate; WL 110547, d.h. 5-Phenoxy-1-[3-(trifluormethyl)-phenyl]-1H-tetrazol; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 und KIH-2023.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

A. Chemische Beispiele

Beispiel 1

2-Amino-4-(2-methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2-yl)-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

- a) 9,3 g (0,11 mol) Cyclopentanon und 13,5 g (0,11 mol)
 2-Chlorpropionsäure-methylester werden auf 0 bis 2 °C gekühlt, bei dieser
 Temperatur werden unter Rühren 13,6 g (0,12 mol) Kalium-tert.-butylat,
 suspendiert in 200 ml Tetrahydrofuran, langsam in einem Zeitraum von ca.
 90 min. zugetropft, anschließend wird noch 60 Minuten ohne Kühlung weiter
 gerührt. Zum Reaktionsgemisch wird etwas Wasser zugeben, diese Mischung
 wird mit Diethylether extrahiert, die organische Phase mit Natriumsulfat
 getrocknet, das Trockenmittel wird abfiltriert und nach Abdampfen des
 Lösungsmittel erhält man 10,6 g 2-Methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2carbonsäuremethylester, welcher ohne weitere Reinigung in der Folgestufe
 eingesetzt werden kann (siehe b).
- b) Zu 5,4 g (0,018 mol) 2-Biguanidino-1-(3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Methanol und 6 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 0,86 g (0,036 mol) Natrium und 50 ml Methanol hergestellte Methanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,3 g (0,028 mol) 2-Methyl-1-oxaspiro[2,4]heptan-2-carbonsäuremethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 1,8 g (25 % d.Th.) 2-Amino-4-(2-methyl-1-oxaspiro[2,4]heptan-2-yl)-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Beispiel 19

2-Amino-4-cyclobutyl-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

Zu 7,2 g (0,025 mol) 2-Biguanidino-1-(3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Methanol und 7 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 1,2 g (0,05 mol) Natrium und 100 ml Methanol hergestellte Methanolatiösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,2 g (0,045 mol) Cyclobutancarbonsäure-ethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 3,5 g (39 % d.Th.) 2-Amino-4-cyclobutyl-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Beispiel 29

2-Amino-4-cyclopropyl-6-(1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

Zu 10,3 g (0,03 mol) 2-Biguanidino-1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Ethanol und 10 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 1,5 g (0,06 mol) Natrium und 100 ml Ethanol hergestellte Ethanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,2 g (0,045 mol) Cyclopropancarbonsäure-ethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als

Laufmittel 1,5 g (14 % d.Th.) 2-Amino-4-cyclopropyl-6-(1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Die in der Tabelle 1 beschriebenen Verbindungen erhält man analog zu den vorstehenden Beispielen 1, 19 und 29. In der Tabelle bedeuten:

Nr. = Beispiel oder Beispielnummer

Fp. = Festpunkt (Schmelzpunkt) in °C oder eine Angabe zum Aggregatzustand oder eine andere Angabe,

z. B. I, II = Diastereomer(engemisch) I oder II

Me = Methyl

Et = Ethyl

Pr = Propyl

i-Pr = Isopropyl

c-Pr = Cyclopropyl

t-Bu = tertiär-Butyl

Ph = Phenyl

Ziffern = 1. Ziffer vor Substituenten bedeutet Position des

Substituenten am Aromaten

2. Ziffer vor Heterocyclenresten bedeutet

Radikalposition in bezug auf Heteroatom, z. B.

2-Pyridinyl = -2-pyridin = Pyridin-2-yl

Cyclobutylen = Cyclobut-1,1-diyl

Cyclopentylen = Cyclopent-1,1-diyl

Cyclohexylen = Cyclohex-1,1-diyl

44

Morpholino =
$$-morpholin = -N 0$$

Piperidino = -piperidin =
$$-N$$

2-Thienyl = -2-thieno =
$$\sqrt{S}$$

Tabelle 1: Verbindungen der Formel (I)

		Fp.	80 - 81				110	111	flüssig	flüssig	flüssig	58 - 62		
		\	0		0		0		0		0	0	0	0
		×	0		0		CMe ₂		CMe ₂	CM ₈₂	CH ₂	GH ₂	0	0
	ور و ا	(R ⁹),	3,5-Me ₂		3,5-Me,	•	3,5-Me ₂		2,4-Me ₂	3,4-(MeO) ₂	3,5-Me ₂		3,5-Me ₂	
	\uparrow	R ⁸	I		Ŧ		I		Ι	Ξ	Ξ	I	Me	Me
3),	R 7 R 8 1 L C H - Y	R7	Me		Me		Me		Ξ	I	Me	Me	Me	Me
$\stackrel{\times}{\circ}\stackrel{\times}{-}(cR^2R^3)$	×	В ⁶	I		Ŧ		I		н	I	I	Ξ	Ξ	I
ر ' ا	_ \	R5	I		I		I		н	H	I	I	Ι	I
	R 4 R 5 N	R ⁴	I		I		Ŧ		H	H	Н	H	I	I
		(CR ² R ³) _m	Cyclo-	pentylen	Cyclo-	hexylen	CHCH = CMe2		CHCH = CMe ₂	CHCH = CMe2	CCI ₂	င်ငါ	CEt ₂	CHEt
		R¹	Me		Me		Н	-	I	I	Me	Me	C	Ü
		ž.	-		2		6		4	2	9		8	6

1	-	•	•							-	
ž	R.	(CR ⁴ R ³) _m	<u>.</u>	œ.	£	Έ.	ж 8	(R ⁹) _n	×	٨	Fp.
10	IJ	CHEt	I	I	Ξ	Σe	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
	CI	CHEt	I	Ξ	Ξ	I	I	3,5-Me ₂	0	0	
12	н	CF2	I	王	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	fest
13	Me	CH ₂	н	Ι	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	52-55
14	Me	CH ₂	Ι	ェ	I	Ξ	Ξ	3-Me,	₹,	0	
- 1.								4,5-0CH ₂ -0-			
15	<u>.</u>	CH ₂	H	I	I	Me	Me	3,5-Me ₂	С Н 2	0	
16	Et	CH ₂	I	I	CH ₂ OMe	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
17	I	CH ₂	I	I	I	I	I	3-Me,	GH,	0	
ſ								4,5-0CH ₂ 0-	1		
18	ı.	CH ₂	н	I	I	-(CH ₂) ₄ -	214-	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
19	Н	CH ₂ CH ₂	I	Ξ	Ξ	Me	I	3,5-Me ₂	ਤ,	0	flüssia
20	Me	CH ₂	I	I	Ξ	Ξ	I	4,5-Me,	, E	0	
21	Μe	GH.2	I	I	Ξ	Me	I	3,5-Me,	N-Me	0	
22	Me	СН ₂	I	I	I	Me	Ŧ	3,5-(t-8u),	CH,	0	
23	Me	CH ₂	I	I	I	Me	I		સ,	0	
24	F	CH ₂	Ŧ	I	I	Me	I		0	0	
	Me	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ		공 공	0	fest
								4-CI			
	Me	CH ₂	Ξ	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	G,	N	

ž	R,	(CR ² R³) _m	₽¢	R5	H.	R ⁷	R ₈	(R ⁹),	×	٨	Fp.	٠.
27	I	CH ₂	I	Ξ	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH,	0	fest	_
28	Me	CH ₂	I	Ŧ	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	S		- <u>1</u>
29	H	CH ₂	I	I	Ξ	Me	I.	3,5-Me ₂ ,	<u>ਜ</u>	0	143 -	
								4-C			144	
္က	n-Pr	CH ₂	I	Ξ_	H	I	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0		- ₇
31	Me	CH ₂	H	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	G,	0		
								4-CI				
32	P.	CH ₂	I	I	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	63-65	
33	ОМе	CH ₂	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	GH,	0		4/
34	Me	СН2	I	Ξ	I	E	I	3,5-Me ₂	CH,	0		
35	Me	CH ₂	I	Ξ	Me	Ξ	Ξ	3,5-Me ₂	0	0		
36	Me	CH ₂	I	Ξ	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me,	કં	NMe		
37	Σ	CH ₂	Ξ	Ξ	I	Me	Ŧ	3,4,5-Me ₃	ਤੌਂ ਤੋਂ	0	115.	
									1		116	
38	Me	CH ₂	СНО	I	I	ŭ	I	3,5-Me ₂	Э,	0		
39	Н	CH2CH2CH2	I	ェ	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me,	GH,	0	flüssin	
40	F	CH ₂	I	I	I	Me	I		£,	0	fliteein	
	Me	СН2	I	I	Ξ	Me	I	Т	N-Me	0		
42	Me	CH ₂	H	I	I	-i-P.	Ŧ	3,5-Me ₂	유,	0		
		,										

ž	R¹	ICR ² R ³) _m	R4	R5	Re	В,	R ⁸	(R ⁹),	×	>	Fp.
£3	I	ਰ ,	I	I	I	Ξ	I	3-Me,	0	0	
								4,5-0CH ₂ 0-			
44	Me	CH ₂	H	Н	СНО	δ	I	3,5-Me ₂	0	0	
45	ш	сн ₂	Ξ	COMe	I	¥.	I	3,5-Me ₂	д	0	
46	Me	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	4-t-Bu	GH,	0	
47	Me	CH2CH2	I	I	I	Me	Ξ	4-t-Bu	유	0	
48	Me	сн	I	I	I	Me	Ι	4-t-Bu	Н 2	S	
49	Me	СН2	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	д	0	87 - 90
20	Me	CH ₂	I	H	Ξ	-(CH ₂)4-	1214-	3,5-Me ₂	균,	0	104 -
											106
51	Me	СН2	Me	Me	н	I	I	3,4,5-Me ₃	CH ₂	0	
52	ОМе	CH ₂	Н	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
53	OMe	сн2сн2сн2	Н	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
54	1	CH ₂	н	СНО	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
55	Me	CH ₂	Me	Me	I	I	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
56	Me	CH ₂	н	Н	Me	I	Ξ	2,3-Me ₂	CH ₂	0	
	Me	CH ₂	Et	Et	H	r	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
58	Me	CH ₂	I	I	Me	I	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
23	u.	CH2	I	I	I	Me	Ξ	3,4,5-Me ₃	GH2	0	

	T	T	T	T	T	T			T	Т		T	T	T	T	T	T	\top		_
Fp.					fest					124 -	126					flüssig	flüssig			
>	S	0	- ਜੁ	0	0	0		0	CH ₂	0		0	0	0	0	S	0	0	0	
×	GH2	CH ₂	CH ₂	N-Me	유,	G ₂		CH ₂	CH ₂			CH ₂	CH ₂	CH ₂		요,	G ₂	N-Me	GH ₂	
(R ⁹),	3,4,5-Me ₃ (3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ (3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ (3,5-Me ₂ ,	4-CI	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	2,4-Me ₂		3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	2,3,5-Me ₃	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,4-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ ,	
R ₈	I	I	Ι	Ι	Ι	Ξ		Ξ	Ξ	Ξ		I	Ξ	I	Ξ	Ξ	I	I	I	
В,	χ. Θ	Ξ	Σe	Ĕ	Me	Me		Me	I	I		Me	Ŧ	I	Me	Me	I	Me	I	-
Re	H	Н	Н	н	Н	Ξ		CH ₂ OMe	I	I		CH ₂ OMe	I	I	СНО	I	I	I	I	
R ⁵	Н	н	Н	H	H	I		I	I	I		Н	I	Me	н	H	I	I	I	
R4	H	н	н	I	I	H		H	I	I		н	Н	Me	н	Н	I	¥	I	
(CR ² R³) _m	сн₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	СН2СН2	CH ₂		CH ₂	СН2	² нэ		СН2	СН2	СН2	CH ₂	CH ₂	CH ₂	СН2	CH ₂	
R¹	Me	i-Pr	L.	I	Br	F		Ме	Me	Н		Me	Et	Me	Me	Me	н	Me	Me	
Ŋ.	09	61	62	63	64	65		99	1 29	89		69	02	71 1	72 1	73	74	75	92	

ž Ž	R¹	(CR ² R³) _m	R4	R5	R ⁶	В7	R8	(R ⁹) _n	×	٨	Fp.	_
11	Me	CH ₂	I	Ŧ	Ξ	I	Ξ	2,3-Me ₂	CH ₂	0		
78	Me	CH ₂	I	Ξ	Ξ	Me	Ξ	2,3-Me ₂	₩,	0		7
79	OMe	сн2	I	Ξ	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	0		- T
8	Me	CH ₂ CH ₂	н	I	I	I	Μe	2,3-Me ₂	CH ₂	0		7
8	OMe	CH ₂	I	I	Ξ	Me	I	3,5-Me ₂	ਲ,	0		 -
82	I	CH ₂	I	Ξ	Ξ	Ξ	I	3,4-(MeO) ₂	ਚ,		fest	
83	IJ	CH(i-Pr)	I	Ξ	Ξ	Me	Me	3,5-Me ₂	. 0	0		
84	н	CMeCF ₃	I	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me ₂	ਲੇ,	0	flüssia	
82	Me	СНМе	I	I	Ι	Me	I	3,5-Me ₂	0	0	flüssia	
86	Me	CHMe	I	Ξ	I	Me	I	3,5-Me,	0	S		
87	Ξ	СНМе	Ξ	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	ਤੌ	0	58 - 60	
								4 -C	1			
88	I	CHMe	I	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	g,	0	flüssia	
89	LL.	СНМе	H	I	I	Me	Ξ		G.	ಕ		
90	Me	СНМе	I	I	Till I	Me	Me		0	, 0		
91	Me	CMe ₂	Me	Me	Ŧ	Ξ	I		ਲੇ,	0		
92	I	CMe ₂	I	Ŧ	I	Me	I		. 0	0	fact	
93	Me	CMe ₂	I	I	Me	Me	I	1	0	0		
94	Me	CMe ₂	I	I	I	βe	Ŧ		0	0		
										_	-	_

Me	E .	ž.	20.	Re	R/	R8	(R ⁹)_	×	>	2
	CMe ₂	I	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	0	S	i
	CMe ₂	Ŧ	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	CMe,	0	fest
	CMe ₂	I	I	Me	Me	Me	3,5-Me ₂	, 0	0	
	CM ₈₂	Ξ	I	Me	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	0	0	
	CMe ₂	I	I	Me	Me	I	4-t-Bu	0	0	
	CMe ₂	H	I	Me	Me	I	3,4,5-Me ₃	0	0	
	CMe ₂	I	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	0	0	168 -
				·						170
	CMePh	I	I	I	I	I	2,4-Me ₂	0	0	119 -
										120
·	CMePh	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	0	1: 153 -
										155
	CMePh	I	I.	I	¥	I	3,5-Me ₂	0	0	II: 125 -
										128
	CHPh	I	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
	Cyclopentylen	I	H	H	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	77 - 78
							4-CI			
	СНМе	I	H	I	Me	I	3,5-Me ₂ ,	0	0	flüssig
					•		4-CI			

	7		$\overline{}$	7	7		T	-	-	*					-						
Fp.	88-90		89 - 90	64 - 65																	
<u> </u>	0		0	0	0		0	0		0	0	c)	0		0	O				0
×	0		0	0	0		0	0	_	0	0	0)	0		0	0		,	2112	0
(R³),	3,5-Me ₂ ,	4-CI	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ ,	4-CI	2,4-Me ₂	3,5-Me ₂ ,	4·CI	3,5-Me ₂	3,5-Me,	3.5-Me.	4-CI	3,5-Me ₂ ,	4-CI	3,4,5-Me ₃	1				3,5-Me ₂
R ⁸	Ξ		I	I	I		Ξ	Ξ		I	Ξ	I		Ξ		Ξ	Ξ	=			We We
R7	Me		Me	Me	Me		I	₩ W		Me	Me	Me		Me		Me	Μe	Me	Me.		S S
R ⁶	I		I	I	I		I	I		I	I	I		I		I	I	I	ı		
R5	I		н	I	I		I	H		Ι	I	I	,			Н	I	Ī	Ī	1	-
R4	H		I	Н	I		н	I		H	Ξ	I		I		I	I	I	- -	1	
(CR ² R³) _m	CMe ₂		CMe ₂	CHMe	Cyclopentylen		CMe ₂	CMe ₂		CMe ₂	Cyclopentylen	Cyclopentylen		CMe ₂		CMe ₂	CMe ₂	Cyclopentylen	_	CH.	
R	Me		Me	Me	CI			5			IJ	ш							Me		
	108		_ 6	110	=======================================		$\overline{}$	13	_	114	115 (116		117 F	—∔	118 F	119 F	120 F	121 N	122 M	-

											T	 ,			Ī				
G	-	+	+	_	+	+	+			+	\downarrow		_		\downarrow	\downarrow		\bot	
<u>></u>	0	0	C) c	, c	, c				0	2	2	HWe		ਤ	CHMo	5	E	2
×	0	0	0	3	2 0	S	£	1		CHMe	CH.CH.	CECH	CH-CH-	COOMe	cci,	٠	74 . 5	CFCI	
(R³),	3,5-Me ₂	3,5-Me,	3,5-Me,	2,3-(CH ₂) ₂	2,3-(CH-,),	2,3-(CH ₂),	2,3-	(CH ₂ CH ₂ -	OCH2CH2)	2,3-(CH ₂)4	4-Morpho-	lino	2,3-(CH ₃) _E		2,3-(CH ₂) ₄	3,4-(CH.)	8.7	3,4-	(CH ₂ CH ₂ -
ВВ	Me	Me	Me		Ξ	I	I			Ξ	Ξ		Ξ		Ξ	Ξ		Ξ	
R7	Me	Me	Me	Me	Et	ď	n-Bu			t-Bu	S		NMe ₂		СООМе	COMe	- /	CH ₂ Ph	
94 94	Ξ	I	H	NH2	СН2С=СН	CH ₂ CN	СНО			сооме	CH2CC.	G.	сосн		CO-c-Pr	CH ₂ NM ₈₂	-	CH2CH2-	NMe ₂
χ. -	Ξ	Ξ	Ξ	I	Ŧ	Me	Et			c-Pr	Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂	Ξ		Me	
<u> </u>	I	I	I	I	Me	Me	Me			Me	Me		Me		Me	Me		Me	
(CR*R*),m	ÇMe ₂	CMe ₂	Cyclopentylen	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂			CH ₂	CH ₂		CH ₂		CHMe-CHMe	CH ₂		GH2	
Y	Me	Me	Me	CECMe	SCN	CN	129 CONH-Me			CH-Me	NO ₂		CH ₂ OMe				CHCH	SOMe	
Ž.	123	124	125	126	127	128	129		-		131		132		133	134		135	····

130 So ₂ Me GH ₂ Me Et GH ₂ · CH=CH+ H 3.4·ICH ₂ · GHCN GHMe 131 F CH ₂ Me C-Pr CH ₂ CH ₃ · Et H 4-CH ₂ Ph GH ₂ GHMe 132 OCH ₂ Ph CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ C=C· H H 4-CH ₂ Ph GH ₂ CHMe 133 OCOPh CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ · H 4-CH ₂ Ph GH ₃ CHMe 140 OSO ₂ O·Me CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ CH ₃ · CN H 2.3.4.5·Me ₄ O NEt 141 S·CH+ CH ₂ Me Me CH ₂ Me CH ₂ CH ₃ · CN H 2.3.4.5·Me ₄ O NEt 142 O-I4·F·Ph CH ₂ Me CH ₂ Me CH ₂ CH ₃ · CN H 4-COCh ₃ O NH 143 OPr CH ₂ Me CH ₂ Me CH ₂ CH ₃ CH CH-CH H 4-COCh ₃ O NH 144 ONMe ₂ CH ₃ Me Et CH ₂ CH+ CH ₃ CH Et 3·OCF ₃ O O O 145 NMe-CO CH ₃ Me CH ₂ CH-CH+ CH ₃ CH Et 3·OCF ₃ O O O 146 NMe-CO CH ₃ Me CH ₃ CH-CH+ CH ₃ CH Et 3·OCF ₃ O O O 147 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH CH 148 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 149 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 140 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 141 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 142 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 143 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 144 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 145 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 146 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₂ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 147 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 148 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 149 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ H Pr H-CH ₃ N CH-CH 140 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ N CH-CH 140 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ N CH-CH 140 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ N CH-CH 141 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ N CH-CH 141 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ N CH-CH 142 NMe-CO CH ₃ Me Morpholi- CH ₃ Me Mo	ž	R1	(CR ² R³) _m	R4	R ⁵	R ⁶	R7	Rg	(R ⁹) _n	×	٨	Fp	
F CH ₂ CH CH ₂ CH Et H 4-CH ₂ Ph CH ₂ Ph	136		CH ₂	Me	Et	CH ₂ -	CH=CH-	I	3,4-(CH ₂),	CHCN	CHMe		T
F CH₂ Me CH₂CH₂· Et H 4-CH₂Ph CH₂Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₂CH₂· CN H 4-COOMe S CHM6e S CH₃Ph CH₃Ph CH₃Ph CH₂CH₂· H 4-COOMe S CHM6e S CH₃Ph CH₂CH₂· H 4-COOMe S CHM6e S CH₃Ph CH₂CH₂· H 4-COOMe S CHM6e S CH₃Ph CH₂CH₂· H 4-COOMe S CHM6e CH₃Ph CH₂CH₂· H 4-CCF₃¹· O CH CH₃Ph CH₂CH₂· H CH₂CH₂· CH CH₂CH₂· H CH₂CH₃· CH CH₂CH₃· CH <th< td=""><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td><td>piperidin</td><td>GH3</td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td></th<>						piperidin	GH3						
OCH2Ph CH2 Me Morpholi- CH2C=C- H H 3-OPh CHMe OCOPh CH2 CH2 CH2 H H 3-OPh CHMe OCOPh CH2 CH2 CH2 CH3 H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CM3 H 4-COOMe S S-CH- CH2 Me H CH2CH2- H 4-COOMe S NMePh CH2 Me H CH2CH2- H 4-OCF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me H CH2CH2- H 4-OCF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me C-F-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O NMe-CO- CH2 CH2	137		CH ₂	Me	c-Pr	CH ₂ CH ₂ -	E	I	4-CH ₂ Ph	CH ₂	CH ₂		
OCCH2Ph CH2 Me Morpholi- CH2C=C- H H 3-OPh CHMe OCOPh CH2 Me NMe2 CH2CMO- CH=CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CN H 2,3,4,5-Me4 O S-CH- CH2 Me H CH2CH2- H 2,3,4,5-Me4 O NMePh NMePh Me H CH2CH2- H 4-CGF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-CGF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-CGF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2-CH2- H 4-CGF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2-CH2- H 4-CGF3- O ONMe2 CH2 Me CH2-CH2- Me CH2-CH3- H 4-CGF3- O ONMe2 CH2 Me CH2-CH2-<						piperidin							
OCOPh CH2- CH2- H 4-COOMe S OCOPh CH2- CH2-COO- CH2-CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2- Me Me CH2CH2- CN H 2.3.4.5-Me4 O S-CH- CH2- Me H CH2CH2- CN H 2.3.4.5-Me4 O NMePh Me H CH2CH2- H 3.5-ICF3/2 O O O-(4-F-Ph) CH2- Me CH2-CH2- H 4-OCF3 O ONMePh CH2- Me CH2-CH2- H 4-OCF3 O ONMePh CH2- Me CH2-CH2- CH3- H 4-CH2- ONMePh	138		CH ₂	Me	Morpholi-	CH2C≖C-	I	Ŧ	3-0Ph	CHMe	CHMe		T
OCOPh CH2 Me NMe2 CH2COO- CH=CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CN H 2,3,4,5-Me4 O S-CH- CH2 Me H CH2CH2- CN H 2,3,4,5-Me4 O NMePh CH2 Me H CH2Ph CH2CH2- H 3,5-(CF3)2 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2Ph CH2CH2- H 4-OCF3 O O-(4-F-Ph) CH2 Me Et CH2(H2Ph CH2CH2- H 4-OCF3 O O-(4-F-Ph) CH2 Me Et CH2(H2Ph CH3 H 4-OCF3 O ON/Me2 CH2 Me Et CH2(H2Ph CH2CH2 R A-OCF3 O ON/Me2 CH2 Me CH2(H2Ph CH2CH2 CH2CH3 O O ON/Me2 CH2 Me CH2CH2 CH2CH3					2	CH ₂ .							
OCOPh CH2 Me NMe2 CH2COO- CH=CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CN H 2,3,4,5-Me4 O S-CH- CH2 Me H CH2CH2- H 2,3,4,5-Me4 O NMePh Me H CH2CH2Ph CH2CH2- H 4.OCF3- O OPr CH2 Me Et CH2CH2Ph CH=CH- H 4.OCF3- O ON/Me2 CH2 Me CH2-CH2Ph CH=CH- H 4.OCF3- O ON/Me2 CH2 Me CH2-CH2Ph CH3- H 4.OCF3- O ON/Me2 CH2 Me Et CH2-CH2Ph CH3- H 4.0CF3- O ON/Me3 CH2 Me C-Pr CH2-CH2Ph CH2-CH3- H 4.0CF3- O ON/Me3 CH2 Me Morpholi- CH2- H 4.1-BU			:			piperidin							
OSO ₂ O-Me CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ CN H 2,3,4,5-Me ₄ O S-CH-DIMEPH CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ H 3,5-(CF ₃) ₂ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ Ph H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ Ph H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₃ H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₃ Me 3-CF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₃ Me 3-CF ₃ O ONMe ₂ CH ₂ Me C-Pr CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₃ O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - CH ₂ CH ₃ O O Me Me Morpholi- CH ₂ CH ₂ H Pr-1-Bu O <td>139</td> <td>_</td> <td>CH₂</td> <td>Me</td> <td>NMe₂</td> <td>СН2СОО-</td> <td>CH=CH-</td> <td>I</td> <td>4-C00Me</td> <td>S</td> <td>NMe</td> <td></td> <td></td>	139	_	CH ₂	Me	NMe ₂	СН2СОО-	CH=CH-	I	4-C00Me	S	NMe		
OSO ₂ O-Me CH ₂ Me NMe ₂ CH ₂ CH ₂ - CN H 2,3,4,5-Me ₄ O S-CH CH ₂ Me H CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ - H 3,5-ICF ₃) ₂ O NMePh CH ₂ Me Me CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me Et CH ₂ (4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C-Pr CH=CH- CH ₂ CN Et 3-t-Bu O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O Me Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O						Me	£						
S-CH CH2 Me H CH2Ph CH2CH2- H 3,5-(F3)2 O NMePh CH2-Fh1 CH2 CH2CH2Ph CH=CH H 4-OCF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2Ph CH=CH H 4-OCF3- O OPr CH2 Me Et CH2-(4-F SCN Me 3-t-Bu O ONM62 CH2 Me C-Pr CH=CH CH2CN Et 3-t-Bu O NMe-CO CH2 Me Morpholi CH2 H Pr 4-t-Bu O Me Morpholi CH2 H Pr 4-t-Bu O	140		CH ₂	Me	NMe ₂	CH2CH2-	S	Ξ	2,3,4,5-Me ₄	0	NEt		Т
S-CH CH ₂ Me H CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ - H 3,5-(CF ₃) ₂ O NMePh CH ₂ CH-Ph CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me CH ₂ (4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C-Pr CH=CH- CH ₂ CN Et 3-t-Bu O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr - t-Bu O Me no morpholin H Pr - t-Bu O O						NO ₂							
NMePh Me Me CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- CH ₃ H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH ₃ H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me C-Pr CH ₂ -(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C-Pr CH=CH- CH ₂ CN Et 3-OCF ₃ O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin H Pr 4-t-Bu O	141		сн ₂	Me	I	CH ₂ Ph	CH ₂ CH ₂ -	Ξ	3,5-(CF ₃) ₂	0	¥		
O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2Ph CH=CH- H 4-OCF3 O OPr CH2 Me Et CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-c-Bu O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH3 H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin CH2 H Pr 4-t-Bu O		NMePh					NMe ₂		!				
OPr CH2 Me Et CH2-(4-F- SCN Me 3·t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3·OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2- H Pr 4·t-Bu O Me no morpholin H Pr 4·t-Bu O	142		CH ₂	Me	Me	CH2CH2Ph	CH=CH-	I	4-0CF ₃	0	0		
OPr CH2 Me Et CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2- H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin morpholin O H Pr 4-t-Bu O							CH3						
ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2 H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin morpholin O O O	143		CH ₂	Me	Et	CH2-(4-F-	SCN	Me	3-t-Bu	0	0		
ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin H Pr 4-t-Bu O						æ.							
NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O	144	ONMe ₂	CH ₂	Me	c-Pr	-ਲ- ਲ-	CH2CN	THE STATE OF	3-0CF,	0	0		
NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O Me morpholin						GH3)				
no morpholin	145	NMe-CO-	CH ₂	Me	Morpholi-	CH ₂ -	I	٩	4-t-Bu	0	0		
		æ	-		2	morpholin							

X Y Fp.						2					, <u> </u>	, £	. E	. <u>£</u>	2 H 2 CH3	CH ₃	2 2 1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-	2 ± 2.	2 1-1-1 CH3
	0 0			0	o 8	CH ₂	O CH ₂	0 CMe ₂	O CM ₂ O N-CH ₂ -	CM62 CM62 C=CH	CMe ₂ CMe ₂ C N-CH ₂ - C = CH N-COCH ₃	CMe ₂ CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-COCH ₃	CMe ₂ CMe ₂ C N·CH ₂ · C ■ CH N·COCH ₃	CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-COCH ₃	0 CM ₂ CM ₆ 2 C ■ CH N-COCH ₃ O	CH ₂ CMe ₂ CMe ₂ C ■ CH N-COCH ₃ O O O C ■ CH O	CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-CH ₂ C = CH N-COCH ₃ CMe ₃	CMe ₂ CMe ₂ CMe ₂ C=CH N-COCH ₃ O O C=CH CMe ₂	O CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-COCH ₃ O C = CH CH ₂ C Me ₂
0				0	ဝ ဗီ	CH ₂	O CM62	О СМе ₂	CMe ₂	CM62 CM62 O O C=CH	CM62 CM62 C = CH	CM62 CM62 C = CH	CM62 CM62 C=CH N-COCH ₃	CM62 CM62 C = CH O COCH ₃	CH ₂ CMe ₂ CMe ₂ C = CH O C = CH O C = CH O C = CH O CH ₂	CH ₂ CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-COCH ₃ O O C = CH	CM62 CM62 C = CH N-CCH3 O O O O C = CH	CMe ₂ CMe ₂ CMe ₂ C = CH N-COCH ₃ O C = CH CMe ₂	O CH ₂ CMe ₂ C = CH N-CH ₂ C = CH O CH ₂ CMe ₂
4-CH ₂ OMe 0				4-CH ₂ CF ₃ 0			~				2 0		2 0	NMe OMe VHA	Me OMe NHMe NHMe 3-t-Bu	NMe NHMe NHMe 3-t-Bu	Me J-t-Bu	Me OMe OMe OMe 3-t-Bu 3-t-Bu	IMe IMe t-Bu t-Bu
n-Bu 4-C			t-Bu 4-C		CN 4-C				 	 	 	 	 						
CH ₂ C ■ C- CH ₂ - piperidin	cn ₂ -	•	CH ₂ OMe	δ	?														
NHM&	.		NMe ₂ CF	сн2сн2он		CH ₂ CH ₂ O-	CH ₂ CH ₂ O- Me CH ₂ CH ₂ O-	CH ₂ CH ₂ O- Me CH ₂ CH ₂ O- Et		4 4 4		<u> </u>		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·					
F Z			NMe ₂	ı		₩ ⊕					oholi-	oholi-	oholi-	-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i-i	oholi-	-ilo	;÷	i-i-lo	i-jo
e E			Me	Me	4	Me									ō		e e		
£			CH ₂			CH ₂			L _m			Θ	Σ	. Ge	Ğ	HMe	υ	E W	H We
CH2-t-Bu			i-Pr	NHCOPh	NMePh		ء		٤ .	OPh :Me		OPh Me	OPh We		H-Me		6		
	146		147	148	140											150 [151 (152 (153 (154 (154 (154 (154 (155 (155 (155 (155	150 [151 [152 (153 (154 (155 (155 (155 (155 (155 (155 (155	150 [151 [152 [2] [153 [2] [2] [2] [2] [2] [2] [2] [2] [2] [2]	150 [151 [152 [153 [154 [155 [156 [N]]]]]

	T			T		T		T		7		T			T			7		===
Fo.							·- <u>-</u> · · · ,-							÷						
٨	N-Et			0		S		so,	•	0		SO			CH,	•		CHMe		
×	CHMe			CH ₂	1	0		S		CH ₂)	CHMe	_		CH-CH ₂ -	HOTO		유-유,-	COOMe	
(R³),	3-Me,	4-CH ₂ OMe		3-Me,	4-CH ₂ CF ₃	3-Me,	4-COMe	3-Me,	4-C00Me	3-Me,	4-CONMe ₂	3-Me,	4-CONHMe			H ₂			•	
Ra	S			CH ₂ CH ₂ -	NMe ₂	CH=CH-	CH3	SCN		CH ₂ CN		Ξ			CH2C = C- 3-Me,	CH ₂ .	piperidin	CH ₂ OMe 4,5-Me ₂ ,		
R7	CH ₂ Ph			CH=CH-	£	표		Ŧ		CH=CH-	£	2			CH2CH2-	NMe ₂		CH = CH·	ਲ <u>ੇ</u>	
R ⁶	CH2CH2O-	4-CONH2-	£	CH2CH2-	сооме	CH2CH2-	CONH ₂	CH2CH2-	CONM ₆₂	CH2CH2-	2-thiophen	CH2CH2-	(3-Br-2-	thiophen)	CH2CH2-	2-pyridin		CH2CH2-	(3-Ci-	2-pyridin)
R5	표			c-Pr		Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂		I			Me			Ę		
Ŕ⁴	뀹			Pr		Bu		Æ		4-F-Ph		H			н			Me		
(CR ² R³) _m	СНОРҺ			CH-SOMe		CH-COMe		C(Me)OMe		CHC ER CMe		CHC=CH			CHCF = CFCI		•	CH-NMeEt		
R۱	CH ₂ OMe			OPh		.²ноо	С≖СН	SOMe		SO ₂ Me		F			OCH ₂ Ph			осорь		•
Ž.	157			158		159		160	·	161		162			163			164		

Y Fp.	CH,		,,									_ z	z							
	CCI2				Ċ.	CF ₂	GFG GF	CF ₂	CFCI CFCI	CFCI CHCN	CFC CFC	CFCI CFCI CHCN	CHCN CHCN	CHCN CHCN CHMe	CHCN CHCN CHMe	CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN	CHCN CHCN CFCI	CHON CHANGE CFCI	CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN CHCN	CHCN CHCN CHCN C CFCI C CFCI C C C C C C C C C C C C C
4,5-Me ₂ ,	1000	3-0CF ₃			3,5-Me ₂ ,	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ ,	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe 3,5-Me ₂ ,	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂ , 4-t-Bu 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ OMe 3,5-Me ₂ , 4-CH ₂ CF ₃ 3,5-Me ₂ , 4-COMe	•	•		9 7	9 8	9 7 9	
æ					ŭ				ŭ I I	ŭ I	ŭ I I	ŭ I I I	ш т т	ы н н н н осн ₂	Еt н н осн ₂	ек н н осн ₂	ек н н осн ₂	Еt Н Н Н Н Н Н Н Н 1 С Н 2 С Н 2 С Н 2 Н 1 С Н 2 С Н 2	Et H H CH2 CH2 CH2	PER H
SCN	_				CH ₂ CN	CH ₂ CN	CH ₂ CN	CH ₂ CN	CH ₂ C ■ C.	CH ₂ CN H CH ₂ C ≡ C- CH ₂ ·	CH ₂ CN H CH ₂ C ■ C- CH ₂ ·			CH ₂ C CH, CH ₂ O CH ₂ O	CH ₂ C CH ₂ C CH ₂ O CH ₂ O	0 5 E 0	Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q Q	Q Q Q Q	0 5 5	
<u>.</u> .	7	(3-CI-5- F,C-	2-pyridin)		Me	Me	Me Bu	Me Bu	Me Bu	Me F.P.	Me Bu i-Pr	Me Bu i.Pr CH ₂ -(4-Me-	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph)	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph)	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂	Me Bu i-Pr i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂ CH ₂ C ■ CH	Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂ CH ₂ C ■ CH	Bu i.Pr CH ₂ -(4-Me- Ph) NH ₂ CH ₂ C CH ₂ C CH ₂ C CH ₂ C
	c-P.			Г	Morpholi-		rpholi-	.	oholi-	i	-i-i	÷	<u>-</u>	÷	≒	≒	≒	≒	pholi-	pholi-
- BG	}			CF,	,	,, j	CF ₂ Cl	CF ₂ Cl	GF_CI GF_CF_3	CF_CC	CF_CC CF_CCF_3	CF_CC CF_CF_3 CH_CF_3	CF_CCI CF_CF_3 CH_CF_3	CF_CC CF_CCF_3 CH_CCF_3	CF_CC CF_CCF_3 CH_CCF_3	CF_CC CF_CCF_3 CH_CCF_3	CF_CC CF_CCF_3 CH_CCF_3			
ਤਂ-		NMeCH ₂ O-Me		сме-сооме	_		CH-CONHMe	CH-CONHMe									VHMe COPh -t-Bu		VHMe COPh 1-t-Bu	WHMe COPh 1-t-Bu
0.000		ω Θ		S-CHMe-Ph			0-(4-F-Ph)	.F.Ph)		-F-Ph)	-F-Ph)	.F.Ph)	.F.Ph)	O-(4-F-Ph) OEt ONMe ₂	O-(4-F-Ph) OEt ONMe ₂ NMe-CO-	O-(4-F-Ph) OEt ONMe2 NMe-CO- Me CH ₂ -t-Bu	O-(4-F-Ph) OEt ONMe ₂ NMe-CO- Me CH ₂ -t-Bu	O-(4-F-Ph) OEt ONMe ₂ NMe-CO- Me CH ₂ -t-Bu	O-(4-F-Ph) OEt ONMe2 NMe-CO- Me CH2-t-Bu	O-(4-F-Ph) OEt ONMe2 ONMe CO- Me CH2-t-Bu i-Pr
	165			166			167													

(CR ² R ³) _m
4-F-Ph NH ₂
H NM62
CMe-SO ₂ OMe H NHPh
Me NHCH ₂ -
CH ₂ OMe
Bu CH2CH2-
OMe
CF ₃ CH ₂ CH ₂ -
SMe
CF ₂ CI COMe
CF2CF3 COPh
CH ₂ CF ₃ H
Et Me
<u>.</u>

	T	 T		T		7		T		T	7	 	T		_				7	
<u> </u>					-															
٨	CH ₂	CMe ₂		0	•	NPr		N(O)		0	0	0	0)	0		CH,	•	CHMe	
×	0	CH ₂		CMe ₂		0		CHMe		CH ₂ O	0	S		٧.	CHMe		CH(CH ₂ -	C=CH)	CH(CH ₂ -	COOMe)
(R ⁹) _n	2,4-Me ₂	2,4-Me ₂		2,4-Me ₂		2,4-Me ₂	l	2,4-Me ₂		2,4-Me ₂	2,4-Me ₂	2,4-Me ₂	2,4-Me,	•	3,4-(OMe)2	1	3,4-(OMe) ₂		3,4-(OMe) ₂	
R8	CH ₂ SCH ₂	CH ₂ NMe-CH ₂		CH2N(CH2Ph)-CH2		CH2CHMeCH2		CH ₂ CH(NH ₂)CH ₂		CH = CH-CH2CH2					Ē		Me		86	
R7	CH ₂	CH ₂ NN		CH ₂ N(CH		CH2CH		CH ₂ CH(I		CH=CH	CH2CH2-CH=CH	CH2CH = CHCH2	CONMe-CO		I		Ξ		Ξ	
R ⁶	CH ₂ Ph	CH2CH2Ph		CH ₂ -(4-	F-Ph)	-но= но	CH ₃	CH ₂ -	morpholin	NHMe	NMe ₂	СН2СН2ОН	CH2CH2O-	Me	CH2CH20-	Ę	CH2CH2O-	Ph	CH ₂ CH ₂ -	NHPh
RS	c-Pr	Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂		I		Me	Ęŧ	c-Pr	Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂		I	
R ⁴	Bu	£		4-F-Ph		I		I		Me	Bu	CF3	CF ₂ CI		CF ₂ CF ₃		CH ₂ CF ₃		Et	
(CR ² R ³) _m	CH ₂	CH ₂		сн ₂		с т ,		CH ₂		СН2	CH ₂	CH ₂	CH2CH2		CH ₂		CH2CH2CH2		CH ₂	`
R¹	OCH ₂ - C⊞CH	SOMe		SO ₂ Me		u.		OCH ₂ Ph		OCOPh	0S0 ₂ 0-Me	SCHMe-Ph	0-(4-	F-Ph)	0		ONMe ₂		NMeCO-Me	
ž	185	186		187		188		189		190	191	192	193		194		195		1961	

ž	Γα	(CD2D3)	40	80	9-	•					
	5	1CN_N-1m	E.	, -	<u> </u>	àc	e	(R ⁹),	×	\	Fō.
197	CH ₂ -t-Bu	CH ₂	ř	Me	CH2CH2-	I	S	3-0Me,	cci,	ਤੇ,	
		-			NMePh			5-Me	•	•	
198	l-Pr	CH ₂	26	Et	CH2CH20-	Ξ	SCN	3-OMe,	ÇF,	CHMe	
					(4-F-Ph)			5-Me	•		
199	NHCOPh	CH ₂	£	c-Pr	CH2CH2O.	Ξ	NMe ₂	3-SMe, 5-Me	CFC	ਝ	
: ··				*	(3,5-		1			•	
					Me ₂ -Ph)						
200	NMePh	CH ₂	4-F-Ph	Morpholi-	CH2CH2O-	Ξ	CH ₂ NMe ₂	CH ₂ NMe ₂ 3-SO ₃ Me,	CHCN	CHM	
				2	(2,3-Cl ₂ -		1	5-Me			
					£						
201	NHCOPh	CH ₂	Ξ	NH ₂	CH2CH2O-	Ŧ	CH ₂ NHPh	CH2NHPh 3-SMe, 5-CI	ਝੰ	E	
					(4-CONH ₂ -		1		٧.	7	
					æ						
202	C≅CMe	CHCF ₃	I	NMe ₂	CH2CH2-	I	CHMe-	3-SMe,	CHMe	CHMe	
					COOMe		NMe ₂	5-N0 ₂			
203	SCN	CHCF = CHMe	Me	I	CH2CH2-	Ξ	COPh	3-CF,CF,H	S	NMe	
					CONH2			•			
204	CN	CHMe	Br.	Me	CH ₂ CH ₂ -	I	Ξ	3-CF,CF,H.	0	NF	
					CONMe2						
205	CONH-Me	CMeEt	I	ŭ	CH2CH2-	I	COMe	3-CF3, 5-Me	0	Į.	
					2-thiophen			1			

Fp.										,											O O O O O O O O O O
<u>}</u>	0		•	0	, –)	0	0	, 0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0 0	0 0						
×	0			0			0	0	0	0 0	0 0	0 0	0 0	0 0 0	0 0 0	0 0 0	0 0 0				
(R ⁹),	3-CF ₃ , 5-Me			3-SMe, 5-F																	
<u></u>	ä			2.	Pyridinyl		2-Thio-	2-Thio- phenyl	2-Thio- phenyl	2-Thio- phenyl	2-Thio- phenyl	2-Thio- phenyl	2-Thio-phenyl	2-Thio-phenyl	2-Thio-phenyl	2-Thio-phenyl H	2-Thio-phenyl H	2-Thio-phenyl H	2-Thio-phenyl H H Et Et Pr	2-Thio-phenyl H H Et Et	Pr Pr
<u>بر</u>	I			Ξ			I	I	I	I I	I I	I I	I I	ı ı	I I	т r	т r r	т r r	= = = = =	т r r r	т г г т _т
Re	CH2CH2-	(3-Br-	2-thiophen)	CH ₂ CH ₂ -	2-pyridin		CH ₂ CH ₂ -(3-	CH ₂ CH ₂ -(3-	CH ₂ CH ₂ -(3- CI-2- pyridin)	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ -	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5-	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- F ₃ C-2-	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- F ₃ C-2- pyridin)	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- F ₃ C-2- pyridin)	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- F ₃ C-2- pyridin)	CH ₂ CH ₂ -(3- CI-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-CI-5- F ₃ C-2- pyridin) Me	CH ₂ CH ₂ -(3- CI-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-CI-5- F ₃ C-2- pyridin) Me	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- pyridin) Me	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- pyridin) Me Bu i-Pr CH ₂ -(4-Me-	CH ₂ CH ₂ -(3- CI-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-CI-5- Pyridin) Me Bu Eu F ₃ C-2- Pyridin)	CH ₂ CH ₂ -(3- Cl-2- pyridin) CH ₂ CH ₂ - (3-Cl-5- pyridin) Me Bu Ebu i-Pr CH ₂ -(4-Me- Ph)
R5	c-Pr			Morpholi-	ло П	NH ₂	1	1	1	NMe ₂	NM82	NM82	NMe ₂	NMe ₂	NM6 ₂	NMe ₂	NMe ₂	NMe ₂	NMe ₂ H C-Pr	NMe ₂ H C-Pr	NMe ₂ H C-Pr Morpholi-
R*	I			¥		Н				I	I	I	I	エ	エ エ	エーエーエ	エニュ	т т т	x x x x x	т r r r	x x x x x
(CR ² R ³) _m	Cyclobutylen			CMeEt		СНОРҺ				CHSOMe	CHSOMe	CHSOMe	CHSOMe	СНЅОМе	СНЅОМе	CHCOMe CHCOMe	СНСОМе	CHSOMe CHCOMe CHC = CMe			
œ	CF = CH-Me			200		208 CH ₂ 0Me				OPh	OPh	OPh	OPh	0Рh ОСН ₂ -	0Ph 0CH ₂ · C∈CH	OPh OCH ₂ - C ∈ CH SOMe	OPh OCH ₂ - C ∈ CH SOMe	OPh OCH ₂ - C∈CH SOMe	OPh OCH ₂ C∈CH SOMe SO ₂ Me	OPh OCH ₂ · C∈CH SOMe SO ₂ Me	OCH ₂ - C∈CH SO ₂ Me F
ž.	206			207		208				209	209	209	209								

	T		T		T		T		T		T		$\overline{}$			T					_
Ę.																					
<u> </u>	0		0		CH ₂	1	CMe ₂	•	0		NMe		NCH,	•		0	ı	3	7	0	-
×	NCH ₂ -	CCC	N-COCH ₃	•	0	-	CH ₂		CMe2	ı	0	•	CHMe			0		£		сн,	
(R ⁹) _n	4-0CH ₂ -	C≡CPh	4-0CH ₂ -	C=CCH ₃	3,5-Me ₂ ,	4-CS-SMe	3,5-Me ₂ ,	4-CS-OMe	3,5-Me ₂ ,		3,5-Me ₂ ,	4-S0 ₂ Me	3,4-Me ₂ ,			3,5-Me,	4-0Ph	3,5-Me _{3,}		3,5-Me ₂ , (•
R ₈	Ξ		I		Me		Ē		ď		26		Ξ			I		Me		ri.	
R ⁷	Ι		Ι		Ξ		I		Ξ		Me		E			ڇ	<u> </u>	8		I	
Re	CH2CH2-(4-	Me-Ph)	CH ₂ CF ₃		CF ₂ CF ₂ H		-S-CCI3	-	COPh		COCH ₂ Ph		CH ₂ CH ₂ 0-	(4-CONH ₂ -	£.	CH2CH2-	COOMe	CH2CH2-	CONH2	CH2CH2-	2-thiophen
Rs	NH2		NMe ₂		I		Me		Et		c-Pr		Morpholi-	2		NH ₂		NMe ₂		I	
H ⁴	Me		I		Н		I		I		I		I			I	-	I		ı	
(CR ² R ³) _m	CHNMeEt		CH-NMe-	CH ₂ O-Me	CMe-COOMe		CH-CONHMe		CH-NHCOPh		CMe-NH-t-Bu		CH-OSO ₂ Me			CH-COPh		CH-SMe		CH-OPh	
٦¹	ОСОРЬ		OSO ₂ O-Me		SCHMe-Ph		0-(4-F-Ph)		oWe O		ONMe ₂		NMeCO-Me (CH ₂ -t-Bu (.Pr		NHCOPh	
ž	215		216		217	_	218	-	219		220	$\overline{}$	221			222 (223 i		224 N	

Me CH ₂ CH ₂ .	
	ž
Z-thiophen	
CH2CH2-	ŭ
(3-Br-2-	
thiophen)	
CH ₂ CH ₂ -	c-Pr
2-pyridin	
Morpholi- CH ₂ CH ₂ -(3-	Mor
Cl-pyridin)	2
CH2CH2-(3-	NH ₂
CI-5-F3C-2-	
pyridin)	
Me	NMe ₂
8n	NHPh
H ₂ - i-Pr	NHCH ₂ -
Me	CH ₂ OMe
.H2- CH2-4-Me-	CH2CH2-
£	OMe
CH ₂ CH ₂ - CH ₂ CH ₂ -4-	£
e t-Bu-Ph	SMe

	1	7		_		T		T		T							-			
Ģ																				
٨	CMe ₂	c)	0		0		0		0			0		0		CM ₈₂	1		
×	CMe-c-Pr	CMoSO.	OMe	CH ₂	ı	CH ₂		CMeCOO-	Me	CHCONH-	Me		CHNHCO-	£	CMeNH-t-	Bu	CHOSO ₂ -			
(R ⁹) _n	4-CH ₂ CH ₂ - OH	4-CH_CH	COOMe	4-CH ₂ CH ₂ -	CONH ₂	4-CH2CH2-	CONMe ₂	3-(CH ₂ CH ₂ -	2-thiophen)	4-(CH2CH2-	(3-Br-2-	thiophen]]	3-(CH ₂ CH ₂ -	2-pyridin)	3-(CH2CH2-		4-{CH ₂ CH ₂ -		CF ₃ -2-	pyridin)}
R ⁸	SCN	NMe		CH ₂ NMe ₂ 4-CH ₂ CH ₂ -		돈		4-F-Ph		2,4-Cl2-Ph 4-1CH2CH2-		- 	Ē		å	<u> </u>	38			
R ⁷	Bu	I		Ι		Me		Ę		ď			Bu		Ξ		Ξ			
R ⁶	CH ₂ CH ₂ -4- Me-Ph	CH,CF,	,	CF2CF2H		-S-CCl3		COPh		COCH ₂ Ph			CH ₂ -c-Pr		NMe ₂		CH ₂ CH ₂ -	NM ₈₂	-	
R ⁵	СОМе	COPh		Ŧ		Ме		CH2CH2CH2CH2		CH2CH2CH2CH2			1 ₂ CH ₂ CH ₂		CH2CH2OCH2CH2		CH2CH2CH2			
R⁴	I	I		Piperidino		Morpho-	lina	CH2CH2C		CH ₂ CH ₂			CH ₂ C		CH2CH2C		CH ₂ CH ₂ (
(CR ² R³) _m	CHC # CH	CHCF = CFCI		CHNMeEt		CHNMeCH ₂ -	OMe	СМеСООМе		CHCONHMe			CHNHCOPh		CMeNH-t-Bu		CHOSO ₂ Me			
R¹	NMe-c-Pr	NH-c-Pr		S-c-Pr		CH = CMe-	c-Pr	CF = CF-Me		C(Me) =	CMe ₂		HS		¥		Н000			
ž	235	236		237		238		239		240			241		242		243			

CHCOPh Morpho- Me CH2CO- Me CN 2-Me CHSMe CH2CH2CH2CH2CH2 CCCH2Ph Et SCN 3-Bu, 4-Me, 5-F CHOPh CH2CH2CH2CH2 CCCH2Ph Et SCN 3-Bu, 4-Me, 5-F CHOPh CH2CH2CH2CH2 CCCH2Ph Fr NMe2 3.5-Me2 CMe-C-Pr CH2CH2CH2CH2 CH2CH2 H CH2NMPh 3.5-Me2 CMe-SO2OMe CH2CH2CH2CH2 CH2CH2 H CH2NMPh 3.5-Me2 CH-CH3 H H CH3 H 3.5-Me2 CH-CH3 H H H CH3 H 3.5-Me2 CH-CH3 H H H CH3 H <th>Lo</th> <th>-</th> <th>(CD2D3)</th> <th>154</th> <th>5.</th> <th>86</th> <th>,</th> <th>٠</th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>	Lo	-	(CD2D3)	154	5.	86	,	٠				
CHCOPh Me CH_2CO- Me CN 2-Me CHCOPh O CHSMe GH_2CH_2CH_2CH_2 COCH_2Ph Et SCN 3-Bu, 4-Me, GHSMe CHSMe O CHOPh CH_2CH_2CH_2CH_2 COCH_2Ph Ft NMe ₂ 3-5-He-7 CHOPh CHSMe O CHOPh CH_2CH_2CH_2CH_2 CH_2-CPT Pr NMe ₂ 3-5-He-7 CHOPh CH ₂ CHCH_2OMe CH_2CH_2CH_2CH_2 CH_2CH_2 H CH_2NMe ₂ 3-5-Me ₂ CHCH_2O CMe ₂ CMe-SO_2OMe CH_2CH_2CH_2CH_2 CH_2CH_2 H CH_2NMe ₂ H CHMe ₂ N-S-Me ₂ O N-Bu CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3-5-Me ₂ O O O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3-5-Me ₂ O O O CH ₂ H H H CH ₃ H 3-5-Me ₂ O O O	r		ורא־אר) m	×	<u>*</u>	×	œ ·	<u>~</u>	(R³),	×	>	Fp.
CHSMe CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂ CCH₂NMe₂ Et SCN 3-Bu, 4-Me, GHSMe CHSMe C	244 C(JNH ₂	СНСОРЬ	Morpho-	Me	CH2CO-	Me	S	2-Me	CHCOPh	0	
CHSMe CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂ COCH₂Ph Et SCN 3-Bu, 4-Me, GHSMe CHSMe O CHOPh CH₂CH₂CH₂CH₂ CH₂-C-Pr Pr NMe₂ 3,5-HèPl₂ CHOPh				lino		CH ₂ NM ₆₂						
CHOPh CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH CH ₂ -c-Pr Pr NMe ₂ 3.5-(i-Pr) ₂ CHOPh CH ₂ CH CHCH ₂ OMe CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH H CH ₂ NMe ₂ CH ₂ NMe ₂ CMe-c-Pr CH ₂ NMe ₂ CMe-c-Pr CH ₂ NMe ₂ CMe-c-Pr CMe-c-Pr	Z	нсно	CHSMe	CH2CH2CI	42CH2CH2	COCH ₂ Ph	Ę	SCN	3-Bu, 4-Me,	CHSMe	0	
CHOPh CH2CH2CH2CH2 CH2-C-PT Pr NMe2 3,5-ii-Pr)2 CHOPh CH2 CHCH2OMe CH2CH2CH2 NMe2 Bu CH2NMe2 3,5-Me2 CHCH2O- CMe2 CMe-C-Pr CH2CH2CH2 CH2CH2CH2 CH2CH2CH2 H CH2NMPh 3,5-Me2 CMe-C-Pr CMe-C-Pr CMe-SO2OMe CH2CH2CH2CH2 CH2CH2CH2 CH2CM2 H CH2NMPh 3,5-Me2 O N-Bu CH-CH3 H H H H H 3,5-Me2 O O CH2 H H H CH3 H 3,5-Me2 O O CH2 H H H CH3 H 3,5-Me2 O O CH-CH3 H H H H CH3 H 3,5-Me2 O O O CH-CH3 H H H CH3 H 3,5-Me2 O O O O O O O	l							-	5-F			
CHCH2OMe CH2CH2CH2 NMe2 Bu CH2NMe2 3.5-Me2 CHCH2O- CMe2 CMe-c-Pr CH2CH2OCH2CH2 CH2CH2- CH2CH2- H CH2NHPh 3.5-Me2 CMe-c-Pr CMe-c-Pr <t< td=""><td>Z</td><td>ме-сно</td><td>СНОРЬ</td><td>СН2СН2</td><td>CH₂CH₂</td><td>CH₂-c-Pr</td><td>P.</td><td>NMe₂</td><td>3,5-(i-Pr)₂</td><td>СНОРЬ</td><td>CH₂</td><td></td></t<>	Z	ме-сно	СНОРЬ	СН2СН2	CH ₂ CH ₂	CH ₂ -c-Pr	P.	NMe ₂	3,5-(i-Pr) ₂	СНОРЬ	CH ₂	
CMe-c-Pr CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ ₂	S	020Н	CHCH ₂ 0Me	CH2CF	1 ₂ CH ₂	NMe ₂	BC.	CH ₂ NMe ₂	3,5-Me ₂	CHCH ₂ 0-		
CMe-c-Pr CH2CH2OCH2CH2 CH2CH2-	ŀ									Σe		
MeEt CMe-SO ₂ OMe CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CO- H CHMe- 3,5-Me ₂ O N-Bu CH-CH ₃ H H H CH ₂ OH H CH ₃ OH H 3,5-Me ₂ OH O O CH ₂ H H H CH ₃ OH H 3,5-Me ₂ OH O O CH ₂ H H H H CH ₃ OH H 3,5-Me ₂ OH O O CH ₂ H H H H CH ₂ OH H 3,5-Me ₂ OH O O CH-CH ₃ H H H H H H 3,5-Me ₂ OH O O CH-CH ₃ H H H H H H A-CI O	0	248 0SO ₂ -0Me		сн2сн2с		CH ₂ CH ₂ - NMe ₂	I	CH ₂ NHPh	3,5-Me ₂	CMe-c-Pr	0	
CH-CH ₃ H H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O O CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , CH ₂ O O CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , CH ₂ O O CH ₂ H H H H CH ₃ H 4-Cl O O CH-CH ₃ H H H H H A-Cl O <	10	-NMeEt	CMe-SO ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ (CH2CO-	I		3,5-Me ₂	0	N-Bu	
CH-CH ₃ H H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O O CH ₂ H H H H 3,5-Me ₂ , CH ₂ CH ₂ O CH ₂ H H H CH ₂ O O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O O CH-CH ₃ H H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O O O CH-CH ₃ H H H H H A-CI O <						CH ₂ NMe ₂		NMe ₂				
CH ₂ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , CH ₂ O CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S	I		CH-CH-		I	I	CH ₃		3,5-Me ₂ ,	0	0	71-73
CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , CH ₂ O CH ₂ O CH ₂ H H CH ₃ H GH ₂ H GH ₂ O O O CH-CH ₃ H H CH ₃ H GH ₃ H GH ₂ O O O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S	1 2								4-CI		<u> </u>	
H ₃ CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , 0 0 CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S	☶		CH ₂			I	GH3			G.,	0	171-173
CH ₂ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O O CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S	- 17								4-CI	•		
CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ O O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S S	Ü	ــــ				I	CH3			0	0	
CH-CH ₃ H H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ O O CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S S	- 1								4-CI			
CH-CH ₃ H H CH ₃ H 3,5-Me ₂ , O S	I					I	CH ₃			0	0	61-63
10-4-CI	<u>ප</u>	~~~~				I	ર્ફ			0	S	
	J						***************************************		4-CI			

ž	R	(CR ² R ³) _m	R ⁴	RS	Re	R7	ВВ	(R ⁹),	×	<u> </u>	Fp.	_
	I	CMe ₂	Ξ	I	I	CH3	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	_	
						•		₽- 1				
256	I	CH2-CH2-CH2	н	I	I	Ι	Ŧ	2,4-Me ₂	CH ₂	0	flüssig	
257	Me	CH ₂	Ŧ	I	Ξ	Ι	Ξ	2,4-Me ₂	CH ₂	0	flüssig	 -
258	ЮН	СН2	Ŧ	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0		
259	Me	CH ₂	I	I	Ξ	Me	Ŧ	I	CH ₂	CH ₂	flüssig	
260	I	CH ₂	H	н	I	Me	I	I	CH ₂	В 3		7
261	Me	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	CH ₂	0	flüssig	_
								4-7				
262	Me	Е	I	I	I	Me	I	3,4-CI	CH ₂	0	108 -	
											110	
	œ W	CH ₂	I	I	I	Me	I	3-Me,	GH ₂	0		-
\rightarrow								5-iPr				
$\overline{}$	Me	CH ₂	н	I	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	CH ₂	CH ₂	flüssig	
$\overline{}$	Me	CH ₂	H	I	I	Ē	Ŧ	3,5-Me ₂	CH ₂	CH ₂		
266	Me	CH ₂	I	Ŧ	I	i-Pr	Ι	3,5-Me ₂	CH ₂	ਲ,	flüssig	
	F	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	I	CH ₂	CH,	50 - 52	
	F	² нэ	I	I	I	ŭ	Ξ	I	CH,	GH,		
	r	CH ₂	I	I	I	Me	I	2,3-Me ₂	CH ₂	. 0	flüssig	
									•			

	T		T	T	T	T	T	T	T	T	T		Τ	Т		T	T	T	
Fp.	flüssia		fest	flüssig	fest	flüssig	55 - 60				_	flüssig	flüssig	flüssig)* -:	flüssig	flüssia	122.	124
>	0		0	0	0	0	0	0	0	0	0		0	0		Д ,		0	
×	£,	•	GH ₂	유,	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH2	CH ₂	CH ₂	CH ₂	д .	GH2	CH ₂		GH ₂	G,		ı
(R ⁹),	2,3-Me,		3,5-Me	3,5-Me	3,5-Me	3-Me	3,5-Me	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	72	 	+-	3-Me,	5-0Me		3,5-(OMe) ₂	\top	
R ⁸	I		Me		Μœ	I	Ξ	I	I	I	I	H	H	H	<u>.</u>	I	H	Ε	
R7	₩ W		Me	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	r	Me	Me	ŦĬ.	Me	Me	Me	Me	iii	Me		Me	Me	2-Thienyl	
R ⁶	I	_	I	I	I	I	I	Ŧ	I	I	I	r	I	I		I	I	I	
ЯS	I	٠	H	H	I	Ξ	н	I	Ξ	Ι	I	I	I	I		I	x	I	
ф ,	I		I	Н	н	H	H	I	н	H	I	I	Ŧ	I		x	I	ı	
(CR ² R ³) _m	CH2CH2CH2-	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	СН2	СН2-СН2	CH ₂ -CH ₂	СН2	CH ₂	CH ₂		CH ₂ -CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂				
œ.	I		Me	Me	Me	Me	Me	Me	Er	i-Pr (Me	Me (Me	Me		Me	M C	Me	
ž	270	i	271	272	273	274	275	276	777	278	279 N	280 N	281 N	282 N		283 N	284 N	285 N	

Ņ.	R¹	(CR ² R ³) _m	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R7	R ₈	(R ⁹),	×	٨	Fp.
286	Me	CH ₂	I	I	Ξ	3-CI,	Ξ	3,5-Me ₂	GH,	0	127.
						4-F-Ph			ı		128
287 Me	Me	CH ₂	Ŧ	I	Ξ	3-Me-Ph	Ξ	3,5-Me ₂	ਲ,	0	
288	8 Me	CH ₂	I	I	Ŧ	Me	I	3-Br	ਲੇ,	0	
289 Me		CH ₂	I	I	I	Me	F	3-CI	GH,	0	
290 Me	Me	СН2	Ŧ	I	I	Me	Ξ	3-Et	CH2	0	

- B. Formulierungsbeispi le
- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I), 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I), 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),
 - 10 " ligninsulfonsaures Calcium,
 - 5 " Natriumlaurylsulfat,
 - 3 " Polyvinylalkohol und
 - 7 " Kaolin

mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett

durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),

5 * 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium

2 " oleoylmethyltaurinsaures Natrium,

1 Gewichtsteil Polyvinylalkohol,

17 Gewichtsteile Calciumcarbonat und

50 Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

C. Biologische Beispiel

1. Unkrautwirkung im Vorauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen werden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wäßrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 I/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. Auflaufschäden erfolgt nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Testergebnisse zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen eine gute herbizide Vorauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 262, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Chrysanthemum segetum, Avena sativa, Stellaria media, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retrofluxus und Panicum miliaceum im Vorauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern werden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im

Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 I/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht und nach ca. 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Die erfindungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Chrysanthemum segetum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retroflexus, Panicum miliaceum und Avena sativa im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

3. Wirkung auf Schadpflanzen in Reis

Verpflanzter und gesäter Reis sowie typische Reisunkräuter werden im Gewächshaus bis zum Dreiblattstadium (Echinochloa 1,5-Blatt) unter Paddyreis-Bedingungen (Anstauhöhe des Wassers: 2 - 3 cm) in geschlossenen Plastiktöpfen angezogen. Danach erfolgt die Behandlung mit den erfindungsgemäßen Verbindungen. Hierzu werden die formulierten Wirkstoffe in Wasser suspendiert, gelöst bzw. emulgiert und mittels Gießapplikation in das Anstauwasser der Test-pflanzen in unterschiedlichen Dosierungen ausgebracht. Nach der so durchgeführten Behandlung werden die Versuchspflanzen im

Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen aufgestellt und während der gesamten Versuchszeit so gehalten.

Etwa drei Wochen nach der Applikation erfolgt die Auswertung mittels optischer Bonitur der Pflanzenschäden im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen, wobei beispielsweise die Verbindungen Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 262, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tab. 1) sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen zeigen, die typisch für Reiskulturen sind, wie z.B. Cyperus monti, Echinochloa crus-galli, Eleocharis acicularis und Sagittaria pygmaea.

4. Kulturpflanzenverträglichkeit

In weiteren Versuchen im Gewächshaus werden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehmboden ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Ein Teil der Töpfe wird sofort wie unter Abschnitt 1 beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt haben und dann wie unter Abschnitt 2 beschrieben mit den erfindungsgemäßen Substanzen der Formel (I) in unterschiedlichen Dosierungen besprüht. Vier bis fünf Wochen nach der Applikation und Standzeit im Gewächshaus wird mittels optischer Bonitur festgestellt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie z.B. Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben und Kartoffeln im Vorund Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt lassen. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie z.B. Gerste, Weizen, Roggen, Sorghum-Hirsen, Mais oder Reis. Die Verbindungen der Formel (I) zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,

worin

R¹ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z¹-R¹⁰,

R² und R³ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z²-R¹¹ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen carbocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern oder einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest oder

 ${
m R}^4$ und ${
m R}^5$ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe ${
m NR}^4{
m R}^5$ einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4

Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,

- R⁶ Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
 Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis
 10 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder
 Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3
 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf
 letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen
 Acylrest,
- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R⁹ jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, (C2-C6)Alkenyloxy, (C2-C6)Alkinyloxy, (C1-C4)Alkylcarbonyl, (C_1-C_4) Alkyloxycarbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-thiocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylthiocarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthio-thiocarbonyl, wobei die Alkylreste in den letztgenannten 11 Resten unsubstituiert oder substituiert sind, oder (C1- C_4)Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloaikylsulfonyl, (C_1-C_4) Alkoxysulfonyl, Amino, Mono- oder Di- $\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Mono- ode$ C₆)alkyl]aminocarbonyl, (C₁-C₆)Alkanoylamino, N-(C₁-C₆)Alkanoyl-N-(C₁-C₄)alkyl-amino, oder einen Rest der Formel Z⁴-R⁰, wobei Z⁴ wie unten definiert und Ro einen aromatischen, gesättigten oder teilgesättigten carbocyclischen oder heterocyclischen Rest, wobei der cyclische Rest substituiert oder unsubstituiert ist, oder zwei benachbarte Reste R9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus

der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder einen heterocyclischen Rest, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist,
- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR $^\circ$ oder -N(O)-, wobei q = 0, 1 oder 2 ist und R $^\circ$ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S(O)_r-, -NR**- oder -N(O)-, wobei r=0, 1 oder 2 ist und R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel

 -O-, -S(O)_p-, -S(O)_p-O-, -O-S(O)_p-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -O-NR'-,
 -NR'-O-, -NR'-CO-, -CO-NR'- bedeutet und dabei p = 0, 1 oder 2 ist und
 R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
- m 1, 2, 3 oder 4 und
- n 0, 1, 2, 3, 4 oder 5,

bedeuten.

- 2. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- R¹ H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder -Z¹-R¹⁰,
- R² und R³ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder einen Rest der Formel -Z²-R¹¹ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 (C_3-C_8) Cycloalkyl, (C_3-C_8) Cycloalkenyl oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch

einen oder mehrer Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino R⁴ und R⁵ oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C2-C4)Alkenyloxy, (C2-C4)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)Alkoxy]$ -carbonyl, $[(C_1-C_4)Alkyl]$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- (C_1-C_4) alkyl)-aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $(C_1-C_4)Alkyl$ und $(C_1-C_4)Haloalkyl$ substituiert ist,

oder einen Acylrest oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist,

Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder
Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3
Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf
letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste

aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalk xy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $\{(C_1-C_4)$ Alkoxy $\}$ -carbonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkyl $\}$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $\{(C_1-C_4)$ Alkyl $\}$ -aminocarbonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfinyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfinyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $\{(C_1-C_4)$ Alkylund $\{(C_1-C_4)$ Haloalkyl substituiert ist, oder einen Acylrest,

- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder
 R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl, wobei die letztgenannten fünf Reste unsubstituiert oder durch Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substituiert sind, oder (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkanoylamino oder einen Rest der Formel Z⁴-R^o, worin Z⁴ wie unten definiert ist und R^o (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Cycloalkenyl oder Phenyl bedeutet, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, oder

zwei benachbarte Reste R^9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 1 bis 6 C-Atomen, einem cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 C-Atomen oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl, (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₄)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist,
- x eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR * oder -N(O)-, wobei q = 0, 1 oder 2 ist und R * Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S(O)_r-, -NR**- oder -N(O)-, wobei r=0, 1 oder 2 ist und R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel
 -O-, -S-, -CO-, -O-CO-, -NR'-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R'
 H oder (C₁-C₄)Alkyl ist,

bedeuten.

- 3. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß
- R^1 , R^2 , R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(C_1-C_4)Alkyl$,

Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, Halo (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo- (C_1-C_4) alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4$ (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C1-C4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C1-C4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl (C_1-C_4)$ alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, $(C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Haloalkoxy, Formyl,$ $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy,$ substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils mit 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O, S enthält,

- R² und R³ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR²R³ einen gesättigten oder teilweise ungesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe O, N und S, wobei jeder der letztgenannten 2 cyclischen Reste unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist.
- R^4 und R^5 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl$, $Cyano-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino$, $Halo-(C_1-C_4)alkyl$, $Hydroxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$,

 $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_6)Alkenyl, Halo-(C_2-C_6)alkenyl,$ (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, $\label{eq:continuous} \mbox{Di-[(C$_1$-C$_4)alkyl]-amino-(C$_1$-C$_4)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_1$-C$_4)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_1$-C$_9)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_9$-C$_9)alkyl, (C$_9$-C$_$ (C3-C9)Cycloalkyl, (C3-C9)Heterocycl-(C1-C4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C1-C4)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist,

 $\begin{array}{lll} \mathsf{R}^6 & \mathsf{Wasserstoff}, \, \mathsf{Amino}, \, \mathsf{Formyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkyl}, \, \mathsf{Cyano}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkylamino}, \, \mathsf{Di}\mathsf{-}[(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}]\mathsf{-}\mathsf{amino}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Hydroxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkoxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Halo}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkoxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{Alkenyl}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{Alkinyl}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{alkinyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkylamino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Di}\mathsf{-}[(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}]\mathsf{-}\mathsf{amino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_3\mathsf{-}\mathsf{C}_9)\mathsf{Cycloalkylamino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ \end{array}$

 (C_3-C_9) Cycloalkyl, (C_3-C_9) Hetercycl- (C_1-C_4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, (C_1-C_4) Aikylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy,$ substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C1-C4)Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, $\{C_1-C_4\}Alkoxy-\{C_1-C_4\}alkyl$, $Halo\{C_1-C_4\}alkoxy-\{C_1-C_4\}alkyl$, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo- (C_1-C_4) alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, $\label{eq:Halo-C2-C6-Alkenyl} \mbox{Halo-(C2-C6)Alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl,} \\$ $(C_1-C_4) \\ Alkylamino-(C_1-C_4) \\ alkyl, \\ Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4) \\ alkyl, \\ Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino$ (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C1-C4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-$ (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

 R^9 , wenn n = 1 ist, und die Reste R^9 , jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkyl}$, Cyano- $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{alkyl}$, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkoxy}$, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkylamino}$, Di-[(C1-C4)alkyl]-amino, Halo-(C1-C4)alkyl, Hydroxy-(C1-C4)alkyl, (C1-C4)Alkoxy-(C1-C4)alkyl, Halo-(C1-C4)alkyl, Halo-(C1-C4)alkyl, (C1-C4)Alkylthio, Halo-(C1-C4)alkylthio, (C2-C6)Alkenyl, Halo-(C2-C6)Alkenyl, (C2-C6)Alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl, (C1-C4)Alkylamino-(C1-C4)alkyl, Di-[(C1-C4)alkyl]-amino-(C1-C4)alkyl, (C3-C9)Cycloalkylamino-(C1-C4)alkyl, (C3-C9)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C1-C4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere este aus der Gruppe (C1-C4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy,

Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome oder 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist öder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-

bedeuten.

- 4. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß
- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ Alkyl)-amino,

Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl oder Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen gesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern, der unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C_1-C_4) Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,

- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl oder Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder Phenoxy-carbonyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil bis zu dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder
 - R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weiter Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,
- Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Dialkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylamino-carbonyl oder einen der letztgenannten fünf Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- $\rm R^7$ und $\rm R^8$ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Di-{(C₁-C₄)alkyl}-amino-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl,

Phenyl-(C_1 - C_4)alkyl oder einen der letztgenannt in drei Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy und (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R⁹ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]$ amino, Perhalo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_2-C_6)Alkenyl,$ (C_2-C_6) Alkinyl, Di- (C_1-C_4) alkyl)-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxycarbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylcarbonyl,$ $(C_1-C_4)Alkyloxycarbonyl, Phenoxy-<math>(C_1-C_4)alkyl, Phenyl-(C_1-C_4)alkyl,$ Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 13 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten 3 bis 6 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N und O aufweist, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste (C1-C4)Alkyl substituiert ist,

eine Gruppe der Formel -O- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Methyl ist, oder eine Gruppe der Formel CR*¹³R*¹⁴, wobei die Definitionen für R*¹³ und R*¹⁴ aus den für R*² und R*³ möglichen Resten ausgewählt sind,

- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Methyl ist, bedeuten.
- 5. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß
- R¹ Wasserstoff, Halogen oder (C₁-C₄)Alkyl,
- ${
 m R}^2$ und ${
 m R}^3$ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, (C $_1$ -C $_4$)Alkyl oder Phenyl oder

 ${
m R}^2$ und ${
m R}^3$ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe ${
m CR}^2{
m R}^3$ gesättigtes ${
m (C_4-C_6)Cycloalkyl},$

R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl oder (C₁-C₄)Alkyl oder R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

R⁶ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

 R^7 und R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl oder R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen,

 R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, $(C_1-C_4)Alkyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

m 1 oder 2.

n 2 oder 3,

- X eine Gruppe der Formel -O- oder -NH- oder eine Gruppe der Formel $CR^{13}R^{14}$, wobei die Definitionen für R^{13} und R^{14} aus den für R^2 und R^3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NHbedeuten.

- 6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) oder der n Salzen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man
- a) eine Verbindung der Formel (II),

$$R^{1} - C \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \qquad (II)$$

worin R¹⁵ eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carbonsäureester, Carbonsäureorthoester, Carbonsäurechlorid, Carbonsäureamid, Carbonsäureanhydrid und Trichlormethyl bedeutet, mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

b) eine Verbindung der Formel (IV),

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N & N & N & N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^{4}R^{5}N & N & R^{16}
\end{array}$$

worin R¹⁶ einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet, mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

c) unter Reaktion einer austauschfähigen Gruppe am Triazin der Verbindungen der genannten Formel (IV) oder der Formel (X),

$$R^{1} - C \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m}$$

$$R^{16} \longrightarrow N \longrightarrow R^{16}$$

$$(X)$$

worin jeder der Reste R¹⁶ unabhängig voneinander einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet, diese Verbindung mit einem geeigneten Aziridin der Formel (XI),

worin R⁷ und R⁸ wie in Formel (I) definiert sind, und nachfolgend mit einem geeigneten Nucleophil der Formel (XII)

unter Ringöffnung des Azirididinrings und, falls ein Triazin der Formel (X) eingesetzt wurde, durch Reaktion der noch vorhandenen austauschfähigen Gruppe am Triazingrundgerüst mit einer Verbindung der Formel NHR⁴R⁵ umsetzt oder

d) eine V rbindung der Formel (XIII)

durch Epoxidierung oder Cyclopropanierung in entsprechende Verbindungen der Formel (I) umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (X), (XI), (XII) und (XIII) die Reste R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 sowie X, Y, m und n wie in Formel (I) definiert sind, mit der Maßgabe, daß in Variante d) m=1 ist.

- 7. Herbizides oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß es mindestens eine Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 und im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel enthält.
- 8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge von mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 auf die Schadpflanzen bzw. Pflanzen, deren Pflanzensamen oder die Fläche, auf der sie wachsen, appliziert.
- 9. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 5 als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.

10. Verbindungen der Formel (IV),

$$\begin{array}{c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N \\
R^{4}R^{5}N & N \\
\end{array}$$
(1V)

worin ${\bf R}^1$ bis ${\bf R}^5$, X und m wie in Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind und

 R^{16} (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkylthio, Phenyl-(C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkylphenylthio oder (C₁-C₄)Alkylphenylsulfonyl bedeutet.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter nat Application No PCT/EP 96/02479

A CLAS	SIEICATION OF SUBJECT MATTER	·	PCT/EP 96/02479
IPC 6	SIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D405/04 A01N43/68 C07D	251/18	
	to International Patent Classification (IPC) or to both national	I classification and IPC	
	OS SEARCHED		
IPC 6			
Document	ation searched other than minimum documentation to the exten	t that such documents are incl	uded in the fields searched
Electronic	data have consulted during the international search (name of da	ata base and, where practical,	search terms used)
C. DOCUM	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of	the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP,A,0 411 153 (IDEMITSU KOSAN LTD) 6 February 1991 cited in the application see claims	COMPANY	1,7
A	EP,A,0 509 544 (IDEMITSU KOSAN LTD) 21 October 1992 cited in the application see claims	COMPANY	1,7
-			
Furt	her documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family me	embers are listed in annex.
A' docume consider of filing of the which is citation of the mention of the menti	ent which may throw doubts on priority claim(s) or is cited to establish the publication date of another n or other special reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or	or priority date and a cited to understand a cited to invention "X" document of particul cannot be considered involve an inventive "Y" document of particul cannot be considered document is combined.	thed after the international filing date not in conflict with the application but the principle or theory underlying the as relevance; the claimed invention I novel or cannot be considered to step when the document is taken alone ar relevance; the claimed invention I to involve an inventive step when the ed with one or more other such document in the document invention being obvious to a person skilled
ate of the	actual completion of the international search		s international search report
4	September 1996	12.	09. 96
lame and m	nailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijnwijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Van Bijle	en, H

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT Inter nal Application No

PCT/EP 96/02479

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP-A-411153		AU-B- AU-B-	628138 5082790	10-09-92 05-09-90
		CA-A,C EP-A-	2027562 0620220	21-08-90
		WO-A-	9009378	19-10-94 23-08-90
		JP-A- JP-B-	7112981 7039400	02-05-95 01-05-95
		KR-B-	9401728	05-03-94
•		LV-B- US-A-	10864 5403815	20-06-96 04-04-95
		US-A-	5290754	01-03-94
************		LT-A,B	640	27-12-94
EP-A-509544	21-10-92	JP-A- US-A-	5320145 5250686	03-12-93 05-10-93

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inter coales Aktenzeichen
PCT/EP 96/02479

		PCT/E	EP 96/02479
A. KLAS IPK 6	SIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES C07D405/04 A01N43/68 C07D25	1/18	
Nach der I	nternationalen Patentkiassifikation (IPK) oder nach der nationaler	n Klassifikation und der IPK	
	ERCHIERTE GEBIETE		
Recherchie IPK 6	rter Mindestprüßstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssy CO7D A01N	Thbole)	
Recherchie	rte aber nicht zum Mindestprüßtoff gehörende Veröffentlichungen	, soweit diese unter die recherchierten	Gehiete fallen
Während d	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank	(Name der Datenbank und evil. veru	vendete Suchbegriffe)
C. ALS W	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter An	gabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,O 411 153 (IDEMITSU KOSAN COMPANY LTD) 6.Februar 1991 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche		1,7
A	EP,A,O 509 544 (IDEMITSU KOSAN (LTD) 21.0ktober 1992 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche	1,7	
Weite	ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu	X Siche Anhang Patentiamilie	
cmane	hmen Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
'A" Veröffe aber ni 'E" älteres I Anmele 'L" Veröffe	ntlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, cht als besonders bedeutsam anzusehen ist Ookument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen dedatum veröffentlicht worden ist atlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch aussichhaft er	Anmeldung richt kollidiert, sond Erfindung zugrundeliegenden Pri Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer	em nur zumVerständnis des der nzips oder der ihr zugrundeliegenden Bedeutung: die beanswuchte Erfindun
anderer soll ode ausgefi Veröffe eine Be	n zu issen, oder durch die das Verollentlichungsdatum einer n im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden er die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie bri) nttichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, nttichung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht rdichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach	erindenscher i angkeit beruhend "Y" Veröffentlichung von besonderer kann nicht als auf erfinderischer werden, wenn die Veröffentlichur Veröffentlichungen dieser Katego diese Verbindung für einen Fachs	Bedeutung, die beanspruchte Erfindun, l'ätigkeit beruhend betrachtet 13 mit einer oder mehreren anderen 11e in Verbindung gebracht wird und 11ann nahellegend ist
	anspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist bachlusses der internationalen Recherche	*&" Veröffentlichung, die Mitglied der	
	September 1996	1 2, 09.96	n reenerchenberichts
lame und P	ostanschrift der Internationale Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijitwijk	Bevollmächtigter Bediensteter	
	Tel. (+31-70) 340-2040, Thr. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Van Bijlen, H	

1

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inter nates Aktenzeichen
PCT/EP 96/02479

Im Recherchenbericht geführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied Patentf	(er) der amilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A-411153	06-02-91	AU-B-	628138	10-09-92
		AU-B- CA-A.C	5082790 2027562	05-09-90 21-08-90
		EP-A-	0620220	19-10-94
		₩0-A- JP-A-	9009378 7112981	23-08-90 02-05-95
		JP-B-	7039400	01-05-95
		KR-B-	9401728	05-03-94
		LV-B- US-A-	10864 5403815	20-06-96 04-04-95
		US-A-	5290754	01-03-94
		LT-A,B	640	27-12-94
EP-A-509544	21-10-92	JP-A-	5320145	03-12-93
		US-A-	5250686	05-10-93

		<i>i</i> , ,
		•) b) o'
		•
•		